

061705

10/ 510, 242

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2003 年 10 月 23 日 (23.10.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/086377 A1(51) 国際特許分類⁷: A61K 31/18, 31/22, 31/255,
31/341, 31/36, 31/407, 31/4184, 45/00, 31/166, 31/167,
A61P 35/00, 43/00, C07D 235/14, 307/52, 317/58(MUTO, Susumu) [JP/JP]; 〒184-0003 東京都 小金井市
緑町 1-6-7 メイプルコーポ B 202 Tokyo (JP).
板井 昭子 (ITAI, Akiko) [JP/JP]; 〒113-0031 東京都 文
京区 本郷 5-1 6-6 Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP03/04986

(74) 代理人: 特許業務法人特許事務所サイクス (SIKS &
CO.); 〒104-0031 東京都 中央区 京橋一丁目 8 番 7 号
京橋日殖ビル 8 階 Tokyo (JP).

(22) 国際出願日: 2003 年 4 月 18 日 (18.04.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO,
NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL,
TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU,
ZA, ZM, ZW.

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2002-115629 2002 年 4 月 18 日 (18.04.2002) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 株式会社
医薬分子設計研究所 (INSTITUTE OF MEDICINAL
MOLECULAR DESIGN, INC.) [JP/JP]; 〒113-0033 東
京都 文京区 本郷 5 丁目 2 4 番 5 号 角川本郷ビル 4 F
Tokyo (JP).(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ,
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM,
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許
(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,
GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),
OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

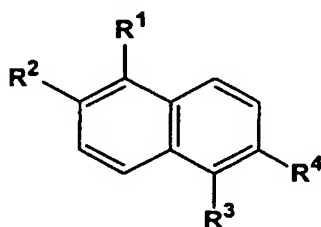
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 武藤 進

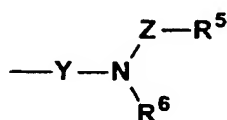
[続葉有]

(54) Title: AMIDE DERIVATIVES

(54) 発明の名称: アミド誘導体



(I)

(57) Abstract: Drugs for potentiating the therapeutic effect
against cancers, the mechanisms of action of which drugs involve
DNA damage, containing compounds represented by the general
formula (I) or salts thereof as the active ingredient: (I) wherein
one of R¹ and R² is hydrogen and the other is -X-A (wherein
A is hydrogen or acyl; and X is oxygen or NH); and one of R³
and R⁴ is hydrogen and the other is a group represented by the
general formula (II): (II) (wherein Y is sulfonyl or carbonyl; R⁵
is a cyclic group; Z is a single bond or C₁₋₄ alkylene; and R⁶ is
hydrogen or C₁₋₆ alkyl).

(II)

[続葉有]

WO 03/086377 A1

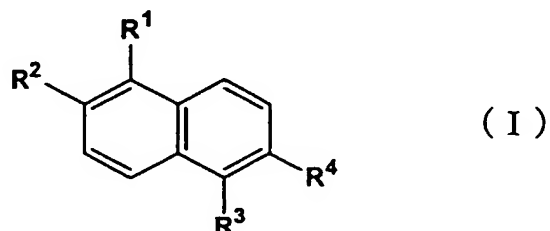


添付公開書類：
— 国際調査報告書

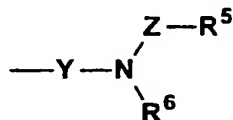
2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

下記一般式 (I) :



〔R¹及びR²は一方が水素原子、他方が式：—X—A（Aは水素原子又はアシル基を示し、Xは酸素原子又はNHを示す）で表される基を示し；R³及びR⁴は一方が水素原子、他方が下記式：



〔Yはスルホニル基又はカルボニル基を示し、R⁵は環式基を示し、Zは単結合又はC₁～C₄のアルキレン基を示し、R⁶は水素原子又はC₁～C₆のアルキル基を示す）で表される基を示す〕で表される化合物又はその塩を有効成分として含みDNA損傷を作用機序とする癌治療の効果を増強するための医薬。

明 細 書

アミド誘導体

技術分野

本発明は、DNA損傷を作用機序とする癌治療の効果を増強するための医薬及び該医薬の有効成分として有用な新規化合物に関するものである。

背景技術

現在癌患者の治療において抗癌剤の投与が行われているが、その延命率の低さも然る事ながら、抗癌剤を投与された癌患者は発熱、吐き気、脱毛、悪寒、倦怠感、免疫機能低下、消化管障害、肝障害、腎障害等の重篤な副作用に耐えなくてはならず、このことが癌患者のQOL (Quality of life) を著しく損なう原因となっている。また、抗癌剤の使用による生ずる癌細胞の抗癌剤に対する感受性の低下が、抗癌剤投与の長期化、投与量の増加を招き、その結果抗癌剤の副作用が原因と思われる死亡例も少なからず見られ、抗癌剤の投与は患者の利益のみならず、社会的、経済的利益を著しく損なうものとなっている。これは、無秩序に分裂、増殖する癌細胞に対し選択的に細胞毒性を発揮するとして使われている抗癌剤が、実際には正常細胞、特に腸や骨髄の細胞に対しても細胞毒として作用してしまうのが原因である。

近年になって低分子有機化合物であるカフェイン、UCN-01 (7-ヒドロキシスタウロスポリン) に放射線耐性のある癌細胞の放射線感受性を増強する作用についての報告がなされている (J. Biol. Chem., 275, 5600-5605 (2000) ; J. Biol. Chem., 276, 17693-17698 (2001))。放射線照射による癌治療もDNAの人為的な損傷を機序とするものであり、ブレオマイシン等のDNAの損傷を機序とする抗癌剤と基本的に同等であると考えられることができるので、既存のDNA損傷を機序とする抗癌剤においても癌細胞への選択毒性を高める薬剤の開発は可能であ

と考えられる。

事実カフェインにおいてはアドリアマイシン、シスプラチン、シクロフォスファミド、マイトマイシンC等のDNA障害を作用機序とする抗癌剤の作用を増強することも報告されている (Jpn. J. Cancer. Res., 80, 83 - 88(1989))。もっとも、作用の強さはいまだ十分とは言えず、毒性との乖離も不十分である。また、UCN-01についても数種類のDNA損傷を作用機序とする抗癌剤の作用を増強することが報告されている (Invest. New Drugs, 18, 95-107(2000))。

抗癌剤の作用増強の作用機序については、カフェイン及びUCN-01が細胞周期の制御にかかわるプロテインキナーゼを阻害することから (J. Biol. Chem., 275, 10342-10348(2000) ; Cancer Res., 61, 1065-1072(2001))、細胞周期のある部分 (例えばG1期, G2期等) の破壊によるものと推定されているが (Cancer Res., 60, 2108-2112(2000) ; Cancer Res., 59, 4375-4382(1999))、未だ確定的な証拠は得られていない。加えて、カフェインおよびスタウルスポリン誘導体であるUNC-01は複数の種類のプロテインキナーゼに対して阻害作用を持つことから (Biochem. Biophys. Res. Commun., 219, 778-783(1996) ; Acta. Pharmacol. Sin., 21 35-40(2000))、細胞周期の破壊以外の作用機序である可能性も否定できず、明確な作用機序は依然として特定されていない。また、これらが細胞内シグナル伝達に関係しているプロテインキナーゼに対しても阻害作用を持つ可能性が高く、このことが重篤な副作用を発現させる可能性があると考えられる。

以上のように、現状ではDNA損傷を作用機序とした癌治療の持つ様々な問題を解決する有効な手段はない。既存のDNA損傷を作用機序とする抗癌剤や放射線照射治療の作用を増強し、癌細胞への選択性をより高める新たな薬剤又は治療法を開発し、副作用を軽減させることは、癌患者のQOL、利益のみならず社会的、経済的利益に重要な貢献するものとなる。

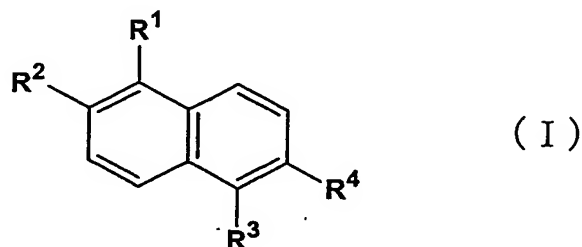
発明の開示

本発明の課題は、DNA損傷を作用機序とする癌治療の効果を増強するための

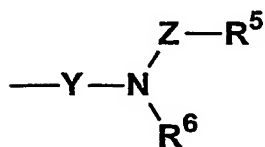
医薬を提供することにある。より具体的には、それ自体では抗癌活性（細胞毒性）は弱い、DNA損傷を作用機序とする抗癌剤または放射線照射のようなDNAに人為的に損傷を与える治療法との併用により、より低い抗癌剤の用量または照射放射線量で癌を選択的に障害または死滅させ、正常細胞への影響を大幅に軽減できる医薬を提供することが本発明の課題である。また、上記の癌治療の効果を増強し、抗癌剤の投与量及び／又は放射線照射量を低減することによって、癌治療に伴う副作用を軽減する医薬を提供することも本発明の課題である。さらに、本発明の別な課題は、上記の医薬の有効成分として有用な新規化合物を提供することにある。

本発明者らは上記課題を解決するためにプロテインキナーゼ阻害剤に着目し、その候補化合物を見出す手段としてコンピューター利用の分子設計技術を用い、所望の薬理活性を持つ化合物の探索を実施した。すなわち、本発明者らは、PDB（Protein Data Bank）に構造が登録されている数種類のプロテインキナーゼのATP結合領域についてリガンドのタンパク質立体構造に基づく化合物3次元データベース自動検索プログラムを用い、市販化合物データベースの化合物の中からヴァーチャル・スクリーニングによりプロテインキナーゼ阻害剤となり得る化合物を選定した。続いて、それらの化合物を骨格別に分類し、その代表的な化合物について癌細胞および正常細胞に対するブレオマイシンとの併用効果、化合物単独での癌細胞および正常細胞への細胞毒性試験を行い、それらの中で活性が強く所望の薬理活性を持つ化合物を選出し、さらにその誘導体合成を行うことにより本発明を完成するに至った。

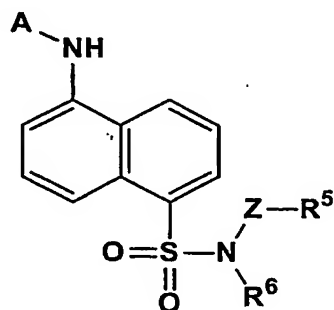
すなわち、本発明は、下記一般式（I）：



〔式中、 R^1 及び R^2 は一方が水素原子、他方が式： $-X-A$ （式中、 A は水素原子又はアシル基を示し、 X は酸素原子又は NH を示す）で表される基を示し； R^3 及び R^4 は一方が水素原子、他方が下記式：



（式中、 Y はスルホニル基又はカルボニル基を示し、 R^5 は置換基を有していてもよい環式基を示し、 Z は単結合又は置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_4$ のアルキレン基を示すが、該 Z が置換基を有する場合には、該置換基は R^5 と結合して環式基を形成してもよく、 R^6 は水素原子又は置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基を示すが、 R^6 は Z 又は R^5 と結合して環式基を形成してもよい）で表される基を示す。ただし、上記一般式（I）が下記式：



（式中、 A 、 Z 、 R^5 、及び R^6 は上記定義と同意義である）である場合を除く〕で表される化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、DNA損傷を作用機序とする癌治療の効果を増強するための医薬を提供するものである。

この発明の好ましい態様によれば、 R^5 が置換基を有していてもよい芳香環式基である上記の医薬； Z が置換基を有していてもよいメチレン基（該 Z が置換基を有する場合、該置換基は R^5 と結合して環式基を形成してもよい）である上記の医薬； Y がスルホニル基である上記の医薬；及び R^1 が式： $-O-A$ （式中、 A は水素原子又はアシル基を示す）で表される基であり、 R^2 が水素原子である

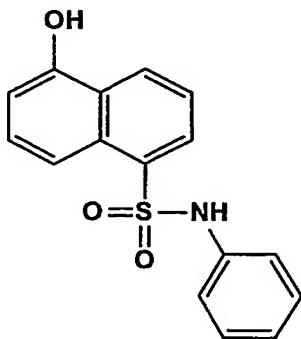
上記の医薬が提供される。

また、上記の発明の好ましい態様により、DNA損傷を作用機序とする癌治療が抗癌剤の投与及び／又は放射線照射により行われる上記医薬；抗癌剤がブレオマイシン、アドリアマイシン、シスプラチン、シクロフォスファミド、マイトマイシンC、及びそれらの誘導体からなる群から選ばれる上記医薬；プロテインキナーゼ及び／又はその類似酵素の特異的阻害剤である上記医薬が提供される。

別の観点からは、上記一般式（I）で表される化合物又は生理学的に許容されるその塩を有効成分として含み、DNA損傷を作用機序とする癌治療の副作用を軽減するための医薬が本発明により提供される。

さらに別の観点からは、上記医薬の製造のための上記一般式（I）で表される化合物又は生理学的に許容されるその塩の使用；ヒトを含む哺乳類動物においてDNA損傷を作用機序とする癌治療の効果を増強するための方法であって、癌患者にDNA損傷を作用機序とする癌治療を行う工程、及び上記癌治療の効果を増強するために十分な量の上記一般式（I）で表される化合物又は生理学的に許容されるその塩を投与する工程を含む方法；ヒトを含む哺乳類動物においてDNA損傷を作用機序とする癌治療の副作用を軽減する方法であって、癌患者にDNA損傷を作用機序とする癌治療を行う工程、及び上記癌治療の副作用を軽減するために十分な量の上記一般式（I）で表される化合物又は生理学的に許容されるその塩を投与する工程を含む方法が提供される。

また、本発明により、上記の一般式（I）で表される化合物（ただし下記の化合物を除く）。



若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

発明を実施するための最良の形態

本明細書において用いられる用語の意味は以下の通りである。

「ハロゲン原子」としては、特に言及する場合を除き、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、又はヨウ素原子のいずれを用いてもよい。

「炭化水素基」としては、例えば、脂肪族炭化水素基、アリール基、アリーレン基、アラルキル基、架橋環式炭化水素基、スピロ環式炭化水素基、及びテルペン系炭化水素等が挙げられる。

「脂肪族炭化水素基」としては、例えば、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルキレン基、アルケニレン基、アルキリデン基等の直鎖状又は分枝鎖状の1価若しくは2価の非環式炭化水素基；シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルカンジエニル基、シクロアルキル-アルキル基、シクロアルキレン基、シクロアルケニレン基等の飽和又は不飽和の1価若しくは2価の脂環式炭化水素基等が挙げられる。

「アルキル基」としては、例えば、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、イソペンチル、2-メチルブチル、1-メチルブチル、ネオペンチル、1, 2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、*n*-ヘキシル、4-メチルペンチル、3-メチルペンチル、2-メチルペンチル、1-メチルペンチル、3, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、2-エチルブチル、1-エチルブチル、1-エチル-1-メチルプロピル、*n*-ヘプチル、*n*-オクチル、*n*-ノニル、*n*-デシル、*n*-ウンデシル、*n*-ドデシル、*n*-トリデシル、*n*-テトラデシル、*n*-ペンタデシル等のC₁~C₁₅の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基が挙げられる。

「アルケニル基」としては、例えば、ビニル、プロパー１－エン－１－イル、アリル、イソプロペニル、ブター１－エン－１－イル、ブター２－エン－１－イル、ブター３－エン－１－イル、２－メチルプロパー２－エン－１－イル、１－メチルプロパー２－エン－１－イル、ペンター１－エン－１－イル、ペンター２－エン－１－イル、ペンター３－エン－１－イル、ペンター４－エン－１－イル、３－メチルブター２－エン－１－イル、３－メチルブター３－エン－１－イル、ヘキサー１－エン－１－イル、ヘキサー２－エン－１－イル、ヘキサー３－エン－１－イル、ヘキサー４－エン－１－イル、ヘキサー５－エン－１－イル、４－メチルペンター３－エン－１－イル、４－メチルペンター４－エン－１－イル、ヘプター１－エン－１－イル、ヘプター６－エン－１－イル、オクター１－エン－１－イル、オクター７－エン－１－イル、ノナー１－エン－１－イル、ノナー８－エン－１－イル、デカー１－エン－１－イル、デカー９－エン－１－イル、ウンデカー１－エン－１－イル、ウンデカー１０－エン－１－イル、ドデカー１－エン－１－イル、ドデカー１１－エン－１－イル、トリデカー１－エン－１－イル、トリデカー１２－エン－１－イル、テトラデカー１－エン－１－イル、テトラデカー１３－エン－１－イル、ペンタデカー１－エン－１－イル、ペンタデカー１４－エン－１－イル等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルケニル基が挙げられる。

「アルキニル基」としては、例えば、エチニル、プロパー１－イン－１－イル、プロパー２－イン－１－イル、ブター１－イン－１－イル、ブター３－イン－１－イル、１－メチルプロパー２－イン－１－イル、ペンター１－イン－１－イル、ペンター４－イン－１－イル、ヘキサー１－イン－１－イル、ヘキサー５－イン－１－イル、ヘプター１－イン－１－イル、ヘプター６－イン－１－イル、オクター１－イン－１－イル、オクター７－イン－１－イル、ノナー１－イン－１－イル、ノナー８－イン－１－イル、デカー１－イン－１－イル、デカー９－イン－１－イル、ウンデカー１－イン－１－イル、ウンデカー１０－イン－１－イル、ドデカー１－イン－１－イル、ドデカー１１－イン－１－イル、トリデカー１－

イン-1-イル、トリデカ-12-イン-1-イル、テトラデカ-1-イン-1-イル、テトラデカ-13-イン-1-イル、ペンタデカ-1-イン-1-イル、ペンタデカ-14-イン-1-イル等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキニル基が挙げられる。

「アルキレン基」としては、例えば、メチレン、エチレン、エタン-1, 1-ジイル、プロパン-1, 3-ジイル、プロパン-1, 2-ジイル、プロパン-2, 2-ジイル、ブタン-1, 4-ジイル、ペンタン-1, 5-ジイル、ヘキサン-1, 6-ジイル、1, 1, 4, 4-テトラメチルブタン-1, 4-ジイル等の $C_1 \sim C_8$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキレン基が挙げられる。

「アルケニレン基」としては、例えば、エテン-1, 2-ジイル、プロペン-1, 3-ジイル、ブタ-1-エン-1, 4-ジイル、ブタ-2-エン-1, 4-ジイル、2-メチルプロペン-1, 3-ジイル、ペンタ-2-エン-1, 5-ジイル、ヘキサ-3-エン-1, 6-ジイル等の $C_1 \sim C_6$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキレン基が挙げられる。

「アルキリデン基」としては、例えば、メチリデン、エチリデン、プロピリデン、イソプロピリデン、ブチリデン、ペンチリデン、ヘキシリデン等の $C_1 \sim C_6$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキリデン基が挙げられる。

「シクロアルキル基」としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル等の $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基が挙げられる。上記「シクロアルキル基」は、ベンゼン環、ナフタレン環等と縮環していてもよく、例えば、1-インダニル、2-インダニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-2-イル等の基が挙げられる。

「シクロアルケニル基」としては、例えば、2-シクロプロペン-1-イル、2-シクロブテン-1-イル、2-シクロペンテン-1-イル、3-シクロペンテン-1-イル、2-シクロヘキセン-1-イル、3-シクロヘキセン-1-イル、1-シクロブテン-1-イル、1-シクロペンテン-1-イル等の $C_3 \sim C_6$

のシクロアルケニル基が挙げられる。上記「シクロアルケニル基」は、ベンゼン環、ナフタレン環等と縮環していてもよく、例えば、1-インダニル、2-インダニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-2-イル、1-インデニル、2-インデニル等の基が挙げられる。

「シクロアルカンジエニル基」としては、例えば、2, 4-シクロペンタンジエン-1-イル、2, 4-シクロヘキサンジエン-1-イル、2, 5-シクロヘキサンジエン-1-イル等のC₅~C₆のシクロアルカンジエニル基が挙げられる。上記「シクロアルカンジエニル基」は、ベンゼン環、ナフタレン環等と縮環していてもよく、例えば、1-インデニル、2-インデニル等の基が挙げられる。

「シクロアルキル-アルキル基」としては、「アルキル基」の1つ以上の水素原子が、「シクロアルキル基」で置換された基が挙げられ、例えば、シクロプロピルメチル、1-シクロプロピルエチル、2-シクロプロピルエチル、3-シクロプロピルプロピル、4-シクロプロピルブチル、5-シクロプロピルペンチル、6-シクロプロピルヘキシル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘプチルメチル、シクロオクチルメチル、6-シクロオクチルヘキシル等のC₄~C₁₄のシクロアルキル-アルキル基が挙げられる。

「シクロアルキレン基」としては、例えば、シクロプロパン-1, 1-ジイル、シクロプロパン-1, 2-ジイル、シクロブタン-1, 1-ジイル、シクロブタン-1, 2-ジイル、シクロブタン-1, 3-ジイル、シクロペンタン-1, 1-ジイル、シクロペンタン-1, 2-ジイル、シクロペンタン-1, 3-ジイル、シクロヘキサン-1, 1-ジイル、シクロヘキサン-1, 2-ジイル、シクロヘキサン-1, 3-ジイル、シクロヘキサン-1, 4-ジイル、シクロヘプタン-1, 1-ジイル、シクロヘプタン-1, 2-ジイル、シクロオクタン-1, 1-ジイル、シクロオクタン-1, 2-ジイル等のC₃~C₈のシクロアルキレン基が

挙げられる。

「シクロアルケニレン基」としては、例えば、2-シクロプロペン-1, 1-ジイル、2-シクロブテン-1, 1-ジイル、2-シクロペンテン-1, 1-ジイル、3-シクロペンテン-1, 1-ジイル、2-シクロヘキセン-1, 1-ジイル、2-シクロヘキセン-1, 2-ジイル、2-シクロヘキセン-1, 4-ジイル、3-シクロヘキセン-1, 1-ジイル、1-シクロブテン-1, 2-ジイル、1-シクロペンテン-1, 2-ジイル、1-シクロヘキセン-1, 2-ジイル等の $C_3 \sim C_6$ のシクロアルケニレン基が挙げられる。

「アリール基」としては、単環式又は縮合多環式芳香族炭化水素基が挙げられ、例えば、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、アントリル、フェナントリル、アセナフチレニル等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基が挙げられる。上記「アリール基」は、上記「 $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基」、「 $C_3 \sim C_6$ のシクロアルケニル基」、又は「 $C_5 \sim C_6$ のシクロアルカンジエニル基」等と縮環していてもよく、例えば、4-インダニル、5-インダニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-5-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-6-イル、3-アセナフテニル、4-アセナフテニル、インデン-4-イル、インデン-5-イル、インデン-6-イル、インデン-7-イル、4-フェナレニル、5-フェナレニル、6-フェナレニル、7-フェナレニル、8-フェナレニル、9-フェナレニル等の基が挙げられる。

「アリーレン基」としては、例えば、1, 2-フェニレン、1, 3-フェニレン、1, 4-フェニレン、ナフタレン-1, 2-ジイル、ナフタレン-1, 3-ジイル、ナフタレン-1, 4-ジイル、ナフタレン-1, 5-ジイル、ナフタレン-1, 6-ジイル、ナフタレン-1, 7-ジイル、ナフタレン-1, 8-ジイル、ナフタレン-2, 3-ジイル、ナフタレン-2, 4-ジイル、ナフタレン-2, 5-ジイル、ナフタレン-2, 6-ジイル、ナフタレン-2, 7-ジイル、ナフタレン-2, 8-ジイル、アントラセン-1, 4-ジイル等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリーレン基が挙げられる。

「アラルキル基」としては、「アルキル基」の1つ以上の水素原子が、「アリール基」で置換された基が挙げられ、例えば、ベンジル、1-ナフチルメチル、2-ナフチルメチル、アントラセニルメチル、フェナントレニルメチル、アセナフチレニルメチル、ジフェニルメチル、1-フェネチル、2-フェネチル、1-(1-ナフチル)エチル、1-(2-ナフチル)エチル、2-(1-ナフチル)エチル、2-(2-ナフチル)エチル、3-フェニルプロピル、3-(1-ナフチル)プロピル、3-(2-ナフチル)プロピル、4-フェニルブチル、4-(1-ナフチル)ブチル、4-(2-ナフチル)ブチル、5-フェニルペンチル、5-(1-ナフチル)ペンチル、5-(2-ナフチル)ペンチル、6-フェニルヘキシル、6-(1-ナフチル)ヘキシル、6-(2-ナフチル)ヘキシル等の $C_7 \sim C_{16}$ のアラルキル基が挙げられる。

「架橋環式炭化水素基」としては、例えば、ビシクロ[2. 1. 0]ペンチル、ビシクロ[2. 2. 1]ヘプチル、ビシクロ[2. 2. 1]オクチル、アダマンチル等の基が挙げられる。

「スピロ環式炭化水素基」としては、例えば、スピロ[3. 4]オクチル、スピロ[4. 5]デカー1, 6-ジエニル等の基が挙げられる。

「テルペン系炭化水素」としては、例えば、ゲラニル、ネリル、リナリル、フィチル、メンチル、ボルニル等の基が挙げられる。

「ハロゲン化アルキル基」としては、「アルキル基」の1以上の水素原子が「ハロゲン原子」で置換された基が挙げられ、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、ブロモメチル、ジブロモメチル、トリブロモメチル、ヨードメチル、ジヨードメチル、トリヨードメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロブチル、パーフルオロヘキシル等の1ないし13個程度のハロゲン原子で置換された $C_1 \sim C_6$ の直鎖状又は分枝鎖状のハロゲン化アルキル基が挙げられる。

「ヘテロ環基」としては、例えば、環系を構成する原子（環構成原子）として、酸素原子、硫黄原子、及び窒素原子等からなる群から選択されたヘテロ原子を少なくとも1個含む単環式又は縮合多環式ヘテロアリール基、並びに、環系を構成する原子（環原子）として、酸素原子、硫黄原子、及び窒素原子等からなる群から選択されたヘテロ原子を少なくとも1個含む単環式又は縮合多環式非芳香族ヘテロ環基が挙げられる。2個以上の環構成ヘテロ原子を含む場合には、それらは同一でも異なってもよい。

「単環式ヘテロアリール基」としては、例えば、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、1-ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル、2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、5-オキサゾリル、3-イソオキサゾリル、4-イソオキサゾリル、5-イソオキサゾリル、2-チアゾリル、4-チアゾリル、5-チアゾリル、3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル、5-イソチアゾリル、1-イミダゾリル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル、5-イミダゾリル、1-ピラゾリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル、5-ピラゾリル、(1, 2, 3-オキサジアゾール)-4-イル、(1, 2, 3-オキサジアゾール)-5-イル、(1, 2, 4-オキサジアゾール)-3-イル、(1, 2, 4-オキサジアゾール)-5-イル、(1, 2, 5-オキサジアゾール)-3-イル、(1, 2, 5-オキサジアゾール)-4-イル、(1, 3, 4-オキサジアゾール)-2-イル、(1, 3, 4-オキサジアゾール)-5-イル、フラザニル、(1, 2, 3-チアジアゾール)-4-イル、(1, 2, 3-チアジアゾール)-5-イル、(1, 2, 4-チアジアゾール)-3-イル、(1, 2, 4-チアジアゾール)-5-イル、(1, 2, 5-チアジアゾール)-3-イル、(1, 2, 5-チアジアゾール)-4-イル、(1, 3, 4-チアジアゾリル)-2-イル、(1, 3, 4-チアジアゾリル)-5-イル、(1H-1, 2, 3-トリアゾール)-1-イル、(1H-1, 2, 3-トリアゾール)-4-イル、(1H-1, 2, 3-トリアゾール)-5-イル、(2H-1, 2, 3-トリアゾール)-2-イル、(2H-1, 2, 3-トリアゾール)-4-イル、(1H-1, 2, 4-トリアゾール)-1-

イル、(1H-1, 2, 4-トリアゾール) - 3-イル、(1H-1, 2, 4-トリアゾール) - 5-イル、(4H-1, 2, 4-トリアゾール) - 3-イル、(4H-1, 2, 4-トリアゾール) - 4-イル、(1H-テトラゾール) - 1-イル、(1H-テトラゾール) - 5-イル、(2H-テトラゾール) - 2-イル、(2H-テトラゾール) - 5-イル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、3-ピリダジニル、4-ピリダジニル、2-ピリミジニル、4-ピリミジニル、5-ピリミジニル、2-ピラジニル、(1, 2, 3-トリアジン) - 4-イル、(1, 2, 3-トリアジン) - 5-イル、(1, 2, 4-トリアジン) - 3-イル、(1, 2, 4-トリアジン) - 5-イル、(1, 2, 4-トリアジン) - 6-イル、(1, 3, 5-トリアジン) - 2-イル、1-アゼピニル、1-アゼピニル、2-アゼピニル、3-アゼピニル、4-アゼピニル、(1, 4-オキサゼピン) - 2-イル、(1, 4-オキサゼピン) - 3-イル、(1, 4-オキサゼピン) - 5-イル、(1, 4-オキサゼピン) - 6-イル、(1, 4-オキサゼピン) - 7-イル、(1, 4-チアゼピン) - 2-イル、(1, 4-チアゼピン) - 3-イル、(1, 4-チアゼピン) - 5-イル、(1, 4-チアゼピン) - 6-イル、(1, 4-チアゼピン) - 7-イル等の5ないし7員の単環式ヘテロアリール基が挙げられる。

「縮合多環式ヘテロアリール基」としては、例えば、2-ベンゾフラニル、3-ベンゾフラニル、4-ベンゾフラニル、5-ベンゾフラニル、6-ベンゾフラニル、7-ベンゾフラニル、1-イソベンゾフラニル、4-イソベンゾフラニル、5-イソベンゾフラニル、2-ベンゾ[b]チエニル、3-ベンゾ[b]チエニル、4-ベンゾ[b]チエニル、5-ベンゾ[b]チエニル、6-ベンゾ[b]チエニル、7-ベンゾ[b]チエニル、1-ベンゾ[c]チエニル、4-ベンゾ[c]チエニル、5-ベンゾ[c]チエニル、1-インドリル、1-インドリル、2-インドリル、3-インドリル、4-インドリル、5-インドリル、6-インドリル、7-インドリル、(2H-イソインドール) - 1-イル、(2H-イソインドール) - 2-イル、(2H-イソインドール) - 4-イル、(2H-イソインドール) - 5-イル、(1H-インダゾール) - 1-イル、(1H-インダゾール)

- 3-イル、(1H-インダゾール) - 4-イル、(1H-インダゾール) - 5-
 イル、(1H-インダゾール) - 6-イル、(1H-インダゾール) - 7-イル、
 (2H-インダゾール) - 1-イル、(2H-インダゾール) - 2-イル、(2H-
 インダゾール) - 4-イル、(2H-インダゾール) - 5-イル、2-ベンゾオ
 キサゾリル、2-ベンゾオキサゾリル、4-ベンゾオキサゾリル、5-ベンゾオ
 キサゾリル、6-ベンゾオキサゾリル、7-ベンゾオキサゾリル、(1, 2-ベン
 ズイソオキサゾール) - 3-イル、(1, 2-ベンズイソオキサゾール) - 4-イ
 ル、(1, 2-ベンズイソオキサゾール) - 5-イル、(1, 2-ベンズイソオキ
 サゾール) - 6-イル、(1, 2-ベンズイソオキサゾール) - 7-イル、(2,
 1-ベンズイソオキサゾール) - 3-イル、(2, 1-ベンズイソオキサゾール)
 - 4-イル、(2, 1-ベンズイソオキサゾール) - 5-イル、(2, 1-ベンズ
 イソオキサゾール) - 6-イル、(2, 1-ベンズイソオキサゾール) - 7-イル、
 2-ベンゾチアゾリル、4-ベンゾチアゾリル、5-ベンゾチアゾリル、6-ベ
 ンゾチアゾリル、7-ベンゾチアゾリル、(1, 2-ベンズイソチアゾール) - 3
 -イル、(1, 2-ベンズイソチアゾール) - 4-イル、(1, 2-ベンズイソチ
 アゾール) - 5-イル、(1, 2-ベンズイソチアゾール) - 6-イル、(1, 2
 -ベンズイソチアゾール) - 7-イル、(2, 1-ベンズイソチアゾール) - 3-
 イル、(2, 1-ベンズイソチアゾール) - 4-イル、(2, 1-ベンズイソチア
 ザール) - 5-イル、(2, 1-ベンズイソチアゾール) - 6-イル、(2, 1-
 ベンズイソチアゾール) - 7-イル、(1, 2, 3-ベンゾオキサジアゾール) -
 4-イル、(1, 2, 3-ベンゾオキサジアゾール) - 5-イル、(1, 2, 3-
 ベンゾオキサジアゾール) - 6-イル、(1, 2, 3-ベンゾオキサジアゾール)
 - 7-イル、(2, 1, 3-ベンゾオキサジアゾール) - 4-イル、(2, 1, 3
 -ベンゾオキサジアゾール) - 5-イル、(1, 2, 3-ベンゾチアジアゾール)
 - 4-イル、(1, 2, 3-ベンゾチアジアゾール) - 5-イル、(1, 2, 3-
 ベンゾチアジアゾール) - 6-イル、(1, 2, 3-ベンゾチアジアゾール) - 7
 -イル、(2, 1, 3-ベンゾチアジアゾール) - 4-イル、(2, 1, 3-ベン

ゾチアジアゾール) - 5 - イル、(1 H - ベンゾトリアゾール) - 1 - イル、(1
 H - ベンゾトリアゾール) - 4 - イル、(1 H - ベンゾトリアゾール) - 5 - イル、
 (1 H - ベンゾトリアゾール) - 6 - イル、(1 H - ベンゾトリアゾール) - 7 -
 イル、(2 H - ベンゾトリアゾール) - 2 - イル、(2 H - ベンゾトリアゾール)
 - 4 - イル、(2 H - ベンゾトリアゾール) - 5 - イル、2 - キノリル、3 - キノ
 リル、4 - キノリル、5 - キノリル、6 - キノリル、7 - キノリル、8 - キノリ
 ル、1 - イソキノリル、3 - イソキノリル、4 - イソキノリル、5 - イソキノリ
 ル、6 - イソキノリル、7 - イソキノリル、8 - イソキノリル、3 - シンノリニ
 ル、4 - シンノリニル、5 - シンノリニル、6 - シンノリニル、7 - シンノリニ
 ル、8 - シンノリニル、2 - キナゾリニル、4 - キナゾリニル、5 - キナゾリニ
 ル、6 - キナゾリニル、7 - キナゾリニル、8 - キナゾリニル、2 - キノキサリ
 ニル、5 - キノキサリニル、6 - キノキサリニル、1 - フタラジニル、5 - フタ
 ラジニル、6 - フタラジニル、2 - ナフチリジニル、3 - ナフチリジニル、4 -
 ナフチリジニル、2 - プリニル、6 - プリニル、7 - プリニル、8 - プリニル、
 2 - プテリジニル、4 - プテリジニル、6 - プテリジニル、7 - プテリジニル、
 1 - カルバゾリル、2 - カルバゾリル、3 - カルバゾリル、4 - カルバゾリル、
 9 - カルバゾリル、2 - (α - カルボリニル)、3 - (α - カルボリニル)、4 -
 (α - カルボリニル)、5 - (α - カルボリニル)、6 - (α - カルボリニル)、7
 - (α - カルボリニル)、8 - (α - カルボリニル)、9 - (α - カルボリニル)、
 1 - (β - カルボニリル)、3 - (β - カルボニリル)、4 - (β - カルボニリル)、
 5 - (β - カルボニリル)、6 - (β - カルボニリル)、7 - (β - カルボニリル)、
 8 - (β - カルボニリル)、9 - (β - カルボニリル)、1 - (γ - カルボリニル)、
 2 - (γ - カルボリニル)、4 - (γ - カルボリニル)、5 - (γ - カルボリニル)、
 6 - (γ - カルボリニル)、7 - (γ - カルボリニル)、8 - (γ - カルボリニル)、
 9 - (γ - カルボリニル)、1 - アクリジニル、2 - アクリジニル、3 - アクリジ
 ニル、4 - アクリジニル、9 - アクリジニル、1 - フェノキサジニル、2 - フェ
 ノキサジニル、3 - フェノキサジニル、4 - フェノキサジニル、10 - フェノキ

サジニル、1-フェノチアジニル、2-フェノチアジニル、3-フェノチアジニル、4-フェノチアジニル、10-フェノチアジニル、1-フェナジニル、2-フェナジニル、1-フェナントリジニル、2-フェナントリジニル、3-フェナントリジニル、4-フェナントリジニル、6-フェナントリジニル、7-フェナントリジニル、8-フェナントリジニル、9-フェナントリジニル、10-フェナントリジニル、2-フェナントロリニル、3-フェナントロリニル、4-フェナントロリニル、5-フェナントロリニル、6-フェナントロリニル、7-フェナントロリニル、8-フェナントロリニル、9-フェナントロリニル、10-フェナントロリニル、1-チアントレニル、2-チアントレニル、1-インドリジニル、2-インドリジニル、3-インドリジニル、5-インドリジニル、6-インドリジニル、7-インドリジニル、8-インドリジニル、1-フェノキサチイニル、2-フェノキサチイニル、3-フェノキサチイニル、4-フェノキサチイニル、チエノ〔2, 3-b〕フリル、ピロロ〔1, 2-b〕ピリダジニル、ピラゾロ〔1, 5-a〕ピリジル、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル、イミダゾ〔1, 5-a〕ピリジル、イミダゾ〔1, 2-b〕ピリダジニル、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリミジニル、1, 2, 4-トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジル、1, 2, 4-トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリダジニル等の8ないし14員の縮合多環式ヘテロアリール基が挙げられる。

「単環式非芳香族ヘテロ環基」としては、例えば、1-アジリジニル、1-アゼチジニル、1-ピロリジニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル、2-テトラヒドロフリル、3-テトラヒドロフリル、チオラニル、1-イミダゾリジニル、2-イミダゾリジニル、4-イミダゾリジニル、1-ピラゾリジニル、3-ピラゾリジニル、4-ピラゾリジニル、1-(2-ピロリニル)、1-(2-イミダゾリニル)、2-(2-イミダゾリニル)、1-(2-ピラゾリニル)、3-(2-ピラゾリニル)、ピペリジノ、2-ピペリジニル、3-ピペリジニル、4-ピペリジニル、1-ホモピペリジニル、2-テトラヒドロピラニル、モルホリノ、(チオモルホリン)-4-イル、1-ピペラジニル、1-ホモピペラジニル等の3な

いし7員の飽和若しくは不飽和の単環式非芳香族ヘテロ環基が挙げられる。

「縮合多環式非芳香族ヘテロ環基」としては、例えば、2-キヌクリジニル、2-クロマニル、3-クロマニル、4-クロマニル、5-クロマニル、6-クロマニル、7-クロマニル、8-クロマニル、1-イソクロマニル、3-イソクロマニル、4-イソクロマニル、5-イソクロマニル、6-イソクロマニル、7-イソクロマニル、8-イソクロマニル、2-チオクロマニル、3-チオクロマニル、4-チオクロマニル、5-チオクロマニル、6-チオクロマニル、7-チオクロマニル、8-チオクロマニル、1-イソチオクロマニル、3-イソチオクロマニル、4-イソチオクロマニル、5-イソチオクロマニル、6-イソチオクロマニル、7-イソチオクロマニル、8-イソチオクロマニル、1-インドリニル、2-インドリニル、3-インドリニル、4-インドリニル、5-インドリニル、6-インドリニル、7-インドリニル、1-イソインドリニル、2-イソインドリニル、4-イソインドリニル、5-イソインドリニル、2-(4H-クロメニル)、3-(4H-クロメニル)、4-(4H-クロメニル)、5-(4H-クロメニル)、6-(4H-クロメニル)、7-(4H-クロメニル)、8-(4H-クロメニル)、1-イソクロメニル、3-イソクロメニル、4-イソクロメニル、5-イソクロメニル、6-イソクロメニル、7-イソクロメニル、8-イソクロメニル、1-(1H-ピロリジニル)、2-(1H-ピロリジニル)、3-(1H-ピロリジニル)、5-(1H-ピロリジニル)、6-(1H-ピロリジニル)、7-(1H-ピロリジニル)等の8ないし10員の飽和若しくは不飽和の縮合多環式非芳香族ヘテロ環基が挙げられる。

上記「ヘテロ環基」において、環系を構成する原子（環構成原子）として、結合手を有する窒素原子の他に、酸素原子、硫黄原子、及び窒素原子等からなる群から選択されたヘテロ原子を1個以上有していてもよい単環式又は縮合多環式ヘテロアリアル基、並びに、環系を構成する原子（環原子）として、結合手を有する窒素原子の他に、酸素原子、硫黄原子、及び窒素原子等からなる群から選択されたヘテロ原子1個以上を有していてもよい単環式又は縮合多環式非芳香族ヘテ

ロ環基を本明細書において「環状アミノ基」と称する。2個以上のヘテロ原子を環構成原子として有する場合には、それらは同一でも異なってもよい。例えば、1-ピロリジニル、1-イミダゾリジニル、1-ピラゾリジニル、1-オキサゾリジニル、1-チアゾリジニル、ピペリジノ、モルホリノ、1-ピペラジニル、チオモルホリン-4-イル、1-ホモピペリジニル、1-ホモピペラジニル、2-ピロリン-1-イル、2-イミダゾリン-1-イル、2-ピラゾリン-1-イル、1-インドリニル、2-イソインドリニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-1-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル、1-ピロリル、1-イミダゾリル、1-ピラゾリル、1-インドリル、1-イミダゾリル、2-イソインドリル等の基が挙げられる。

本明細書において、上記「シクロアルキル基」、「シクロアルケニル基」、「シクロアルカンジエニル基」、「アリール基」、及び「ヘテロ環基」を総称して「環式基」と称する。又、該「環式基」の中で、特に「アリール基」、「単環式ヘテロアリール基」、及び「縮合多環式ヘテロアリール基」を総称して「芳香環式基」と称する。

「炭化水素-オキシ基」としては、「ヒドロキシ基」の水素原子が「炭化水素基」で置換された基が挙げられ、「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。「炭化水素-オキシ基」としては、例えば、アルコキシ基（アルキル-オキシ基）、アルケニル-オキシ基、アルキニル-オキシ基、シクロアルキル-オキシ基、シクロアルキル-アルキル-オキシ基等の脂肪族炭化水素-オキシ基；アリール-オキシ基；アラルキル-オキシ基；アルキレン-ジオキシ基等が挙げられる。

「アルコキシ基（アルキル-オキシ基）」としては、例えば、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、イソプロポキシ、*n*-ブトキシ、イソブトキシ、*sec*-ブトキシ、*tert*-ブトキシ、*n*-ペンチルオキシ、イソペンチルオキシ、2-メチルブトキシ、1-メチルブトキシ、ネオペンチルオキシ、1, 2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、*n*-ヘキシルオキシ、4-メチルペンチルオキシ、3-メチルペンチルオキシ、2-メチルペンチルオキシ、1-メチル

ペンチルオキシ、3, 3-ジメチルブトキシ、2, 2-ジメチルブトキシ、1, 1-ジメチルブトキシ、1, 2-ジメチルブトキシ、1, 3-ジメチルブトキシ、2, 3-ジメチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1-エチルブトキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシ、n-ヘプチルオキシ、n-オクチルオキシ、n-ノニルオキシ、n-デシルオキシ、n-ウンデシルオキシ、n-ドデシルオキシ、n-トリデシルオキシ、n-テトラデシルオキシ、n-ペンタデシルオキシ等の $C_1 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルコキシ基が挙げられる。

「アルケニル-オキシ基」としては、例えば、ビニルオキシ、(プロパー-1-エン-1-イル) オキシ、アリルオキシ、イソプロペニルオキシ、(ブター-1-エン-1-イル) オキシ、(ブター-2-エン-1-イル) オキシ、(ブター-3-エン-1-イル) オキシ、(2-メチルプロパー-2-エン-1-イル) オキシ、(1-メチルプロパー-2-エン-1-イル) オキシ、(ペンター-1-エン-1-イル) オキシ、(ペンター-2-エン-1-イル) オキシ、(ペンター-3-エン-1-イル) オキシ、(ペンター-4-エン-1-イル) オキシ、(3-メチルブター-2-エン-1-イル) オキシ、(3-メチルブター-3-エン-1-イル) オキシ、(ヘキサー-1-エン-1-イル) オキシ、(ヘキサー-2-エン-1-イル) オキシ、(ヘキサー-3-エン-1-イル) オキシ、(ヘキサー-4-エン-1-イル) オキシ、(ヘキサー-5-エン-1-イル) オキシ、(4-メチルペンター-3-エン-1-イル) オキシ、(4-メチルペンター-3-エン-1-イル) オキシ、(ヘプター-1-エン-1-イル) オキシ、(ヘプター-6-エン-1-イル) オキシ、(オクター-1-エン-1-イル) オキシ、(オクター-7-エン-1-イル) オキシ、(ノナー-1-エン-1-イル) オキシ、(ノナー-8-エン-1-イル) オキシ、(デカー-1-エン-1-イル) オキシ、(デカー-9-エン-1-イル) オキシ、(ウンデカー-1-エン-1-イル) オキシ、(ウンデカー-10-エン-1-イル) オキシ、(ドデカー-1-エン-1-イル) オキシ、(ドデカー-11-エン-1-イル) オキシ、(トリデカー-1-エン-1-イル) オキシ、(トリデカー-12-エン-1-イル) オキシ、(テトラデカー-1-エン-1-イル) オキシ、(テトラデカー-13-エン-1-イル)

オキシ、(ペンタデカ-1-エン-1-イル) オキシ、(ペンタデカ-1,4-エン-1-イル) オキシ等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルケニル-オキシ基が挙げられる。

「アルキニル-オキシ基」としては、例えば、エチニルオキシ、(プロパ-1-イン-1-イル) オキシ、(プロパ-2-イン-1-イル) オキシ、(ブタ-1-イン-1-イル) オキシ、(ブタ-3-イン-1-イル) オキシ、(1-メチルプロパ-2-イン-1-イル) オキシ、(ペンタ-1-イン-1-イル) オキシ、(ペンタ-4-イン-1-イル) オキシ、(ヘキサ-1-イン-1-イル) オキシ、(ヘキサ-5-イン-1-イル) オキシ、(ヘプタ-1-イン-1-イル) オキシ、(ヘプタ-6-イン-1-イル) オキシ、(オクタ-1-イン-1-イル) オキシ、(オクタ-7-イン-1-イル) オキシ、(ノナ-1-イン-1-イル) オキシ、(ノナ-8-イン-1-イル) オキシ、(デカ-1-イン-1-イル) オキシ、(デカ-9-イン-1-イル) オキシ、(ウンデカ-1-イン-1-イル) オキシ、(ウンデカ-10-イン-1-イル) オキシ、(ドデカ-1-イン-1-イル) オキシ、(ドデカ-11-イン-1-イル) オキシ、(トリデカ-1-イン-1-イル) オキシ、(トリデカ-12-イン-1-イル) オキシ、(テトラデカ-1-イン-1-イル) オキシ、(テトラデカ-13-イン-1-イル) オキシ、(ペンタデカ-1-イン-1-イル) オキシ、(ペンタデカ-14-イン-1-イル) オキシ等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキニル-オキシ基が挙げられる。

「シクロアルキル-オキシ基」としては、例えば、シクロプロポキシ、シクロブトキシ、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシ、シクロヘプチルオキシ、シクロオクチルオキシ等の $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル-オキシ基が挙げられる。

「シクロアルキル-アルキル-オキシ基」としては、例えば、シクロプロピルメトキシ、1-シクロプロピルエトキシ、2-シクロプロピルエトキシ、3-シクロプロピルプロポキシ、4-シクロプロピルブトキシ、5-シクロプロピルペンチルオキシ、6-シクロプロピルヘキシルオキシ、シクロブチルメトキシ、シ

クロペンチルメトキシ、シクロブチルメトキシ、シクロペンチルメトキシ、シクロヘキシルメトキシ、2-シクロヘキシルエトキシ、3-シクロヘキシルプロポキシ、4-シクロヘキシルブトキシ、シクロヘプチルメトキシ、シクロオクチルメトキシ、6-シクロオクチルヘキシルオキシ等の $C_4 \sim C_{14}$ のシクロアルキル-アルキル-オキシ基が挙げられる。

「アリール-オキシ基」としては、例えば、フェノキシ、1-ナフチルオキシ、2-ナフチルオキシ、アントリルオキシ、フェナントリルオキシ、アセナフチレニルオキシ等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリール-オキシ基が挙げられる。

「アラルキル-オキシ基」としては、例えば、ベンジルオキシ、1-ナフチルメトキシ、2-ナフチルメトキシ、アントラセニルメトキシ、フェナントレニルメトキシ、アセナフチレニルメトキシ、ジフェニルメトキシ、1-フェネチルオキシ、2-フェネチルオキシ、1-(1-ナフチル)エトキシ、1-(2-ナフチル)エトキシ、2-(1-ナフチル)エトキシ、2-(2-ナフチル)エトキシ、3-フェニルプロポキシ、3-(1-ナフチル)プロポキシ、3-(2-ナフチル)プロポキシ、4-フェニルブトキシ、4-(1-ナフチル)ブトキシ、4-(2-ナフチル)ブトキシ、5-フェニルペンチルオキシ、5-(1-ナフチル)ペンチルオキシ、5-(2-ナフチル)ペンチルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、6-(1-ナフチル)ヘキシルオキシ、6-(2-ナフチル)ヘキシルオキシ等の $C_7 \sim C_{16}$ のアラルキル-オキシ基が挙げられる。

「アルキレンジオキシ基」としては、例えば、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、1-メチルメチレンジオキシ、1, 1-ジメチルメチレンジオキシ等の基が挙げられる。

「ハロゲン化アルコキシ基 (ハロゲン化アルキル-オキシ基)」としては、「ヒドロキシ基」の水素原子が「ハロゲン化アルキル基」で置換された基が挙げられ、例えば、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロメトキシ、ブロモメトキシ、ヨードメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、3, 3, 3-トリフルオ

ロブポキシ、ヘプタフルオロブポキシ、ヘプタフルオロイソブポキシ、ノナフルオロブトキシ、パーフルオロヘキシルオキシ等の1～13個程度のハロゲン原子で置換されたC₁～C₆の直鎖状又は分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ基が挙げられる。

「ヘテロ環ーオキシ基」としては、「ヒドロキシ基」の水素原子が、「ヘテロ環基」で置換された基が挙げられ、「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。「ヘテロ環ーオキシ基」としては、例えば、単環式ヘテロアリールーオキシ基、縮合多環式ヘテロアリールーオキシ基、単環式非芳香族ヘテロ環ーオキシ基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環ーオキシ基等が挙げられる。

「単環式ヘテロアリールーオキシ基」としては、例えば、3-チエニルオキシ、(イソキサゾール-3-イル)オキシ、(チアゾール-4-イル)オキシ、2-ピリジルオキシ、3-ピリジルオキシ、4-ピリジルオキシ、(ピリミジン-4-イル)オキシ等の基が挙げられる。

「縮合多環式ヘテロアリールーオキシ基」としては、5-インドリルオキシ、(ベンズイミダゾール-2-イル)オキシ、2-キノリルオキシ、3-キノリルオキシ、4-キノリルオキシ等の基が挙げられる。

「単環式非芳香族ヘテロ環ーオキシ基」としては、例えば、3-ピロリジニルオキシ、4-ピペリジニルオキシ等の基が挙げられる。

「縮合多環式非芳香族ヘテロ環ーオキシ基」としては、例えば、3-インドリニルオキシ、4-クロマニルオキシ等の基が挙げられる。

「炭化水素ースルファニル基」としては、「スルファニル基」の水素原子が、「炭化水素基」で置換された基が挙げられ、「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。「炭化水素ースルファニル基」としては、例えば、アルキルースルファニル基、アルケニルースルファニル基、アルキニルースルファニル基、シクロアルキルースルファニル基、シクロアルキルーアルキルースルファニル基等の脂肪族炭化水素ースルファニル基；アリールースルファニル基、アラルキルースルファニル基等が挙げられる。

「アルキルースルファニル基」としては、例えば、メチルスルファニル、エチルスルファニル、*n*-プロピルスルファニル、イソプロピルスルファニル、*n*-ブチルスルファニル、イソブチルスルファニル、*sec*-ブチルスルファニル、*tert*-ブチルスルファニル、*n*-ペンチルスルファニル、イソペンチルスルファニル、(2-メチルブチル)スルファニル、(1-メチルブチル)スルファニル、ネオペンチルスルファニル、(1, 2-ジメチルプロピル)スルファニル、(1-エチルプロピル)スルファニル、*n*-ヘキシルスルファニル、(4-メチルペンチル)スルファニル、(3-メチルペンチル)スルファニル、(2-メチルペンチル)スルファニル、(1-メチルペンチル)スルファニル、(3, 3-ジメチルブチル)スルファニル、(2, 2-ジメチルブチル)スルファニル、(1, 1-ジメチルブチル)スルファニル、(1, 2-ジメチルブチル)スルファニル、(1, 3-ジメチルブチル)スルファニル、(2, 3-ジメチルブチル)スルファニル、(2-エチルブチル)スルファニル、(1-エチルブチル)スルファニル、(1-エチル-1-メチルプロピル)スルファニル、*n*-ヘプチルスルファニル、*n*-オクチルスルファニル、*n*-ノニルスルファニル、*n*-デシルスルファニル、*n*-ウンデシルスルファニル、*n*-ドデシルスルファニル、*n*-トリデシルスルファニル、*n*-テトラデシルスルファニル、*n*-ペンタデシルスルファニル等のC₁~C₁₅の直鎖状又は分枝鎖状のアルキルースルファニル基が挙げられる。

「アルケニルースルファニル基」としては、例えば、ビニルスルファニル、(プロパー-1-エン-1-イル)スルファニル、アリルスルファニル、イソプロペニルスルファニル、(ブター-1-エン-1-イル)スルファニル、(ブター-2-エン-1-イル)スルファニル、(ブター-3-エン-1-イル)スルファニル、(2-メチルプロパー-2-エン-1-イル)スルファニル、(1-メチルプロパー-2-エン-1-イル)スルファニル、(ペンター-1-エン-1-イル)スルファニル、(ペンター-2-エン-1-イル)スルファニル、(ペンター-3-エン-1-イル)スルファニル、(ペンター-4-エン-1-イル)スルファニル、(3-メチルブター-2-エン-1-イル)スルファニル、(3-メチルブター-3-エン-1-イル)スル

ファニル、(ヘキサー 1-エン-1-イル) スルファニル、(ヘキサー 2-エン-1-イル) スルファニル、(ヘキサー 3-エン-1-イル) スルファニル、(ヘキサー 4-エン-1-イル) スルファニル、(ヘキサー 5-エン-1-イル) スルファニル、(4-メチルペンター 3-エン-1-イル) スルファニル、(4-メチルペンター 3-エン-1-イル) スルファニル、(ヘプター 1-エン-1-イル) スルファニル、(ヘプター 6-エン-1-イル) スルファニル、(オクター 1-エン-1-イル) スルファニル、(オクター 7-エン-1-イル) スルファニル、(ノナー 1-エン-1-イル) スルファニル、(ノナー 8-エン-1-イル) スルファニル、(デカー 1-エン-1-イル) スルファニル、(デカー 9-エン-1-イル) スルファニル、(ウンデカー 1-エン-1-イル) スルファニル、(ウンデカー 10-エン-1-イル) スルファニル、(ドデカー 1-エン-1-イル) スルファニル、(ドデカー 11-エン-1-イル) スルファニル、(トリデカー 1-エン-1-イル) スルファニル、(トリデカー 12-エン-1-イル) スルファニル、(テトラデカー 1-エン-1-イル) スルファニル、(テトラデカー 13-エン-1-イル) スルファニル、(ペンタデカー 1-エン-1-イル) スルファニル、(ペンタデカー 14-エン-1-イル) スルファニル等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルケニル-スルファニル基が挙げられる。

「アルキニル-スルファニル基」としては、例えば、エチニルスルファニル、(プロパー 1-イン-1-イル) スルファニル、(プロパー 2-イン-1-イル) スルファニル、(ブター 1-イン-1-イル) スルファニル、(ブター 3-イン-1-イル) スルファニル、(1-メチルプロパー 2-イン-1-イル) スルファニル、(ペンター 1-イン-1-イル) スルファニル、(ペンター 4-イン-1-イル) スルファニル、(ヘキサー 1-イン-1-イル) スルファニル、(ヘキサー 5-イン-1-イル) スルファニル、(ヘプター 1-イン-1-イル、(ヘプター 6-イン-1-イル) スルファニル、(オクター 1-イン-1-イル) スルファニル、(オクター 7-イン-1-イル) スルファニル、(ノナー 1-イン-1-イル) スルファニル、(ノナー 8-イン-1-イル) スルファニル、(デカー 1-イン-1

ーイル) スルファニル、(デカ-9-イン-1-イル) スルファニル、(ウンデカ-1-イン-1-イル) スルファニル、(ウンデカ-10-イン-1-イル) スルファニル、(ドデカ-1-イン-1-イル) スルファニル、(ドデカ-11-イン-1-イル) スルファニル、(トリデカ-1-イン-1-イル) スルファニル、(トリデカ-12-イン-1-イル) スルファニル、(テトラデカ-1-イン-1-イル) スルファニル、(テトラデカ-13-イン-1-イル) スルファニル、(ペンタデカ-1-イン-1-イル) スルファニル、(ペンタデカ-14-イン-1-イル) スルファニル等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル-スルファニル基が挙げられる。

「シクロアルキル-スルファニル基」としては、例えば、シクロプロピル-スルファニル、シクロブチル-スルファニル、シクロペンチル-スルファニル、シクロヘキシル-スルファニル、シクロヘプチル-スルファニル、シクロオクチル-スルファニル等の $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル-スルファニル基が挙げられる。

「シクロアルキル-アルキル-スルファニル基」としては、例えば、(シクロプロピルメチル) スルファニル、(1-シクロプロピルエチル) スルファニル、(2-シクロプロピルエチル) スルファニル、(3-シクロプロピルプロピル) スルファニル、(4-シクロプロピルブチル) スルファニル、(5-シクロプロピルペンチル) スルファニル、(6-シクロプロピルヘキシル) スルファニル、(シクロブチルメチル) スルファニル、(シクロペンチルメチル) スルファニル、(シクロブチルメチル) スルファニル、(シクロペンチルメチル) スルファニル、(シクロヘキシルメチル) スルファニル、(2-シクロヘキシルエチル) スルファニル、(3-シクロヘキシルプロピル) スルファニル、(4-シクロヘキシルブチル) スルファニル、(シクロヘプチルメチル) スルファニル、(シクロオクチルメチル) スルファニル、(6-シクロオクチルヘキシル) スルファニル等の $C_4 \sim C_{14}$ のシクロアルキル-アルキル-スルファニル基が挙げられる。

「アリール-スルファニル基」としては、例えば、フェニル-スルファニル、1-ナフチル-スルファニル、2-ナフチル-スルファニル、アントリル-スルファニル、

フェナントリルスルファニル、アセナフチレニルスルファニル等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリールースルファニル基が挙げられる。

「アラルキルースルファニル基」としては、例えば、ベンジルスルファニル、(1-ナフチルメチル)スルファニル、(2-ナフチルメチル)スルファニル、(アントラセニルメチル)スルファニル、(フェナントレニルメチル)スルファニル、(アセナフチレニルメチル)スルファニル、(ジフェニルメチル)スルファニル、(1-フェネチル)スルファニル、(2-フェネチル)スルファニル、(1-(1-ナフチル)エチル)スルファニル、(1-(2-ナフチル)エチル)スルファニル、(2-(1-ナフチル)エチル)スルファニル、(2-(2-ナフチル)エチル)スルファニル、(3-フェニルプロピル)スルファニル、(3-(1-ナフチル)プロピル)スルファニル、(3-(2-ナフチル)プロピル)スルファニル、(4-フェニルブチル)スルファニル、(4-(1-ナフチル)ブチル)スルファニル、(4-(2-ナフチル)ブチル)スルファニル、(5-フェニルペンチル)スルファニル、(5-(1-ナフチル)ペンチル)スルファニル、(5-(2-ナフチル)ペンチル)スルファニル、(6-フェニルヘキシル)スルファニル、(6-(1-ナフチル)ヘキシル)スルファニル、(6-(2-ナフチル)ヘキシル)スルファニル等の $C_7 \sim C_{16}$ のアラルキルースルファニル基が挙げられる。

「ハロゲン化アルキルースルファニル基」としては、「スルファニル基」の水素原子が「ハロゲン化アルキル基」で置換された基が挙げられ、例えば、(フルオロメチル)スルファニル、(クロロメチル)スルファニル、(ブロモメチル)スルファニル、(ヨードメチル)スルファニル、(ジフルオロメチル)スルファニル、(トリフルオロメチル)スルファニル、(トリクロロメチル)スルファニル、(2, 2, 2-トリフルオロエチル)スルファニル、(ペンタフルオロエチル)スルファニル、(3, 3, 3-トリフルオロプロピル)スルファニル、(ヘプタフルオロプロピル)スルファニル、(ヘプタフルオロイソプロピル)スルファニル、(ノナフルオロブチル)スルファニル、(パーフルオロヘキシル)スルファニル等の1ないし13個のハロゲン原子で置換された $C_1 \sim C_6$ の直鎖状又は分枝鎖状のハロゲン化アル

キルースルファニル基が挙げられる。

「ヘテロ環ースルファニル基」としては、「スルファニル基」の水素原子が、「ヘテロ環基」で置換された基が挙げられ、「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。「ヘテロ環ースルファニル基」としては、例えば、単環式ヘテロアリールースルファニル基、縮合多環式ヘテロアリールースルファニル基、単環式非芳香族ヘテロ環ースルファニル基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環ースルファニル基等が挙げられる。

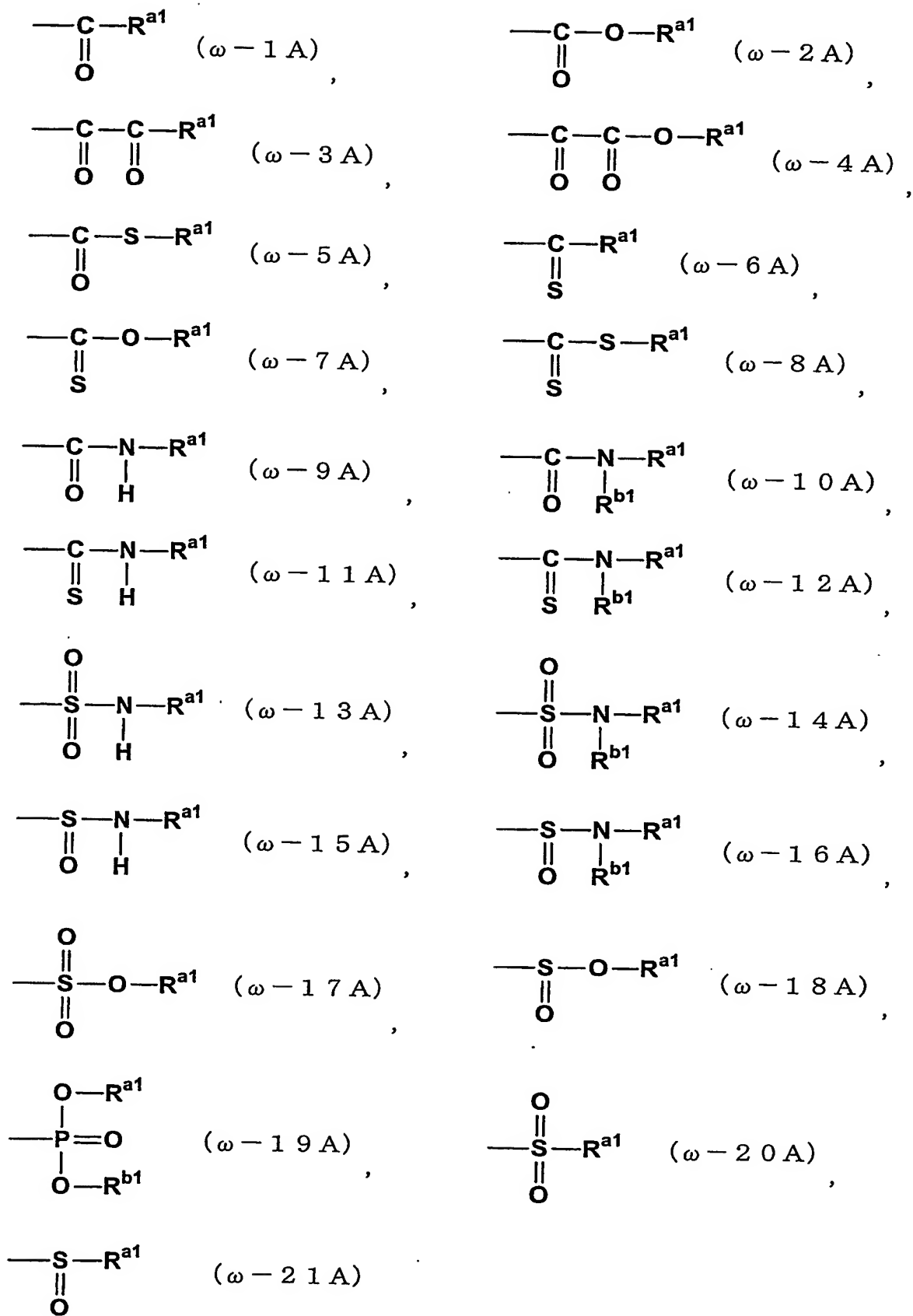
「単環式ヘテロアリールースルファニル基」としては、例えば、(イミダゾールー2-イル)スルファニル、(1, 2, 4-トリアゾールー2-イル)スルファニル、(ピリジンー2-イル)スルファニル、(ピリジンー4-イル)スルファニル、(ピリミジンー2-イル)スルファニル等の基が挙げられる。

「縮合多環式ヘテロアリールースルファニル基」としては、(ベンズイミダゾールー2-イル)スルファニル、(キノリンー2-イル)スルファニル、(キノリンー4-イル)スルファニル等の基が挙げられる。

「単環式非芳香族ヘテロ環ースルファニル基」としては、例えば、(3-ピロリジニル)スルファニル、(4-ピペリジニル)スルファニル等の基が挙げられる。

「縮合多環式非芳香族ヘテロ環ースルファニル基」としては、例えば、(3-インドリニル)スルファニル、(4-クロマニル)スルファニル等の基が挙げられる。

「アシル基」としては、例えば、ホルミル基、グリオキシロイル基、チオホルミル基、及び下記式：



(式中、 R^{a1} 及び R^{b1} はそれぞれ独立に炭化水素基又はヘテロ環基を示すが、 R^{a1} 及び R^{b1} が同一の窒素原子に結合する場合には、 R^{a1} 及び R^{b1} が一緒になってそれらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成してもよい)で表される基が挙げられる。

上記「アシル基」の定義において、

式($\omega-1A$)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素-カルボニル基」(例えば、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、イソバレリル、ピバロイル、ラウロイル、ミリストイル、パルミトイル、アクリロイル、プロピオロイル、メタクリロイル、クロトノイル、イソクロトノイル、シクロヘキシルカルボニル、シクロヘキシルメチルカルボニル、ベンゾイル、1-ナフトイル、2-ナフトイル、フェニルアセチル等の基)、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-カルボニル基」(例えば、2-テノイル、3-フロイル、ニコチノイル、イソニコチノイル等の基)と称する。

式($\omega-2A$)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシカルボニル基」(例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、フェノキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル等の基)、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシカルボニル基」(例えば、3-ピリジルオキシカルボニル等の基)と称する。

式($\omega-3A$)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素-カルボニル-カルボニル基」(例えば、ピルボイル等の基)、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-カルボニル-カルボニル基」と称する。

式($\omega-4A$)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシカルボニル-カルボニル基」(例えば、メトキサリル、エトキサリル等の基)、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシカルボニル-カルボニル基」と称する。

式($\omega-5A$)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素-スルファニル-カルボニル基」、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スル

「フェニル-カルボニル基」と称する。

式(ω-6A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素-チオカルボニル基」、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-チオカルボニル基」と称する。

式(ω-7A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-チオカルボニル基」、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-チオカルボニル基」と称する。

式(ω-8A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素-スルファニル-チオカルボニル基」、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルファニル-チオカルボニル基」と称する。

式(ω-9A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-カルバモイル基」(例えば、N-メチルカルバモイル等の基)、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-カルバモイル基」と称する。

式(ω-10A)で表される基の中で、 R^{a1} 及び R^{b1} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-カルバモイル基」(例えば、N, N-ジメチルカルバモイル等の基)、 R^{a1} 及び R^{b1} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-カルバモイル基」、 R^{a1} が炭化水素基であり R^{b1} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-置換カルバモイル基」、 R^{a1} 及び R^{b1} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「環状アミノ-カルボニル基」(例えば、モルホリノカルボニル等の基)と称する。

式(ω-11A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-チオカルバモイル基」、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-チオカルバモイル基」と称する。

式(ω-12A)で表される基の中で、 R^{a1} 及び R^{b1} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-チオカルバモイル基」、 R^{a1} 及び R^{b1} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-チオカルバモイル基」、 R^{a1} が炭化水素基であり R^{b1} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-チオカルバモイ

ル基」、 R^{a1} 及び R^{b1} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「環状アミノチオカルボニル基」と称する。

式(ω-13A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルファモイル基」、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルファモイル基」と称する。

式(ω-14A)で表される基の中で、 R^{a1} 及び R^{b1} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-スルファモイル基」(例えば、N, N-ジメチルスルファモイル等の基)、 R^{a1} 及び R^{b1} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)スルファモイル基」、 R^{a1} が炭化水素基であり R^{b1} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルファモイル基」、 R^{a1} 及び R^{b1} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「環状アミノ-スルホニル基」(例えば、1-ピロリルスルホニル等の基)と称する。

式(ω-15A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルフィナモイル基」、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルフィナモイル基」と称する。

式(ω-16A)で表される基の中で、 R^{a1} 及び R^{b1} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-スルフィナモイル基」、 R^{a1} 及び R^{b1} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-スルフィナモイル基」、 R^{a1} が炭化水素基であり R^{b1} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルフィナモイル基」、 R^{a1} 及び R^{b1} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「環状アミノ-スルフィニル基」と称する。

式(ω-17A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルホニル基」、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルホニル基」と称する。

式(ω-18A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルフィニル基」、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルフィニル基」と称する。

式(ω-19A)で表される基の中で、 R^{a1} 及び R^{b1} が炭化水素基である基を「O, O'-ジ(炭化水素)-ホスホノ基」、 R^{a1} 及び R^{b1} がヘテロ環基である基を「O, O'-ジ(ヘテロ環)-ホスホノ基」、 R^{a1} が炭化水素基であり R^{b1} がヘテロ環基である基を「O-炭化水素-O'-ヘテロ環-ホスホノ基」と称する。

式(ω-20A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素-スルホニル基」(例えば、メタンスルホニル、ベンゼンスルホニル等の基)、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルホニル基」と称する。

式(ω-21A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素-スルフィニル基」(例えば、メチルスルフィニル、ベンゼンスルフィニル等の基)、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルフィニル基」と称する。

上記式(ω-1A)ないし(ω-21A)で表される基における「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式(ω-1A)で表される「炭化水素-カルボニル基」としては、アルキルーカルボニル基、アルケニルーカルボニル基、アルキニルーカルボニル基、シクロアルキルーカルボニル基、シクロアルケニルーカルボニル基、シクロアルカンジエニルーカルボニル基、シクロアルキルーアルキルーカルボニル基等の脂肪族炭化水素-カルボニル基；アリールーカルボニル基；アラルキルーカルボニル基；架橋環式炭化水素-カルボニル基；スピロ環式炭化水素-カルボニル基；テルペン系炭化水素-カルボニル基が挙げられる。以下、式(ω-2A)ないし(ω-21A)で表される基も同様である。

上記式(ω-1A)ないし(ω-21A)で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式(ω-1A)で表される「ヘテロ環-カルボニル基」としては、例えば、単環式ヘテロアリールーカルボニル基、縮合多環式ヘテロアリールーカルボニル基、単環式非芳香族ヘテロ環-カルボニル基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環-カルボニル基が挙げられる。以下、式(ω-2A)ないし(ω-21A)で表される基も同様である。上記式(ω-10A)ないし(ω-16A)で表される基における「環状アミノ」

としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

上記「アシル基」、「カルバモイル基」、「チオカルバモイル基」、「スルファモイル基」、及び「スルフィナモイル基」を総称して、「置換基を有していてもよいアシル基」と称する。

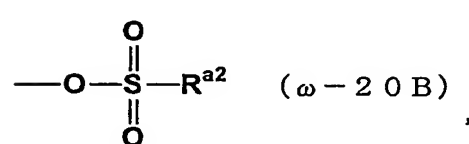
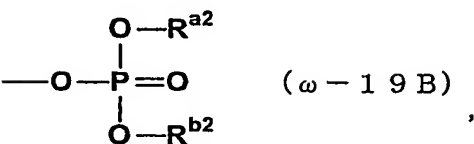
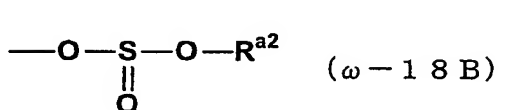
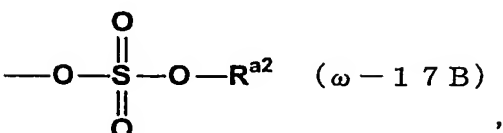
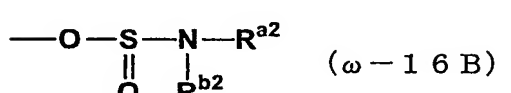
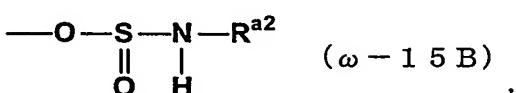
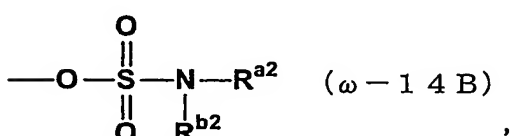
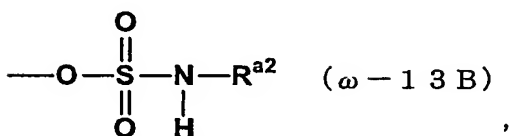
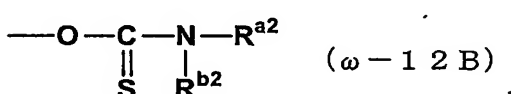
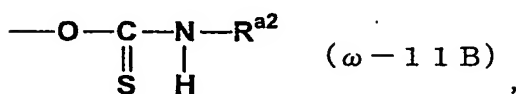
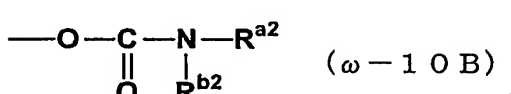
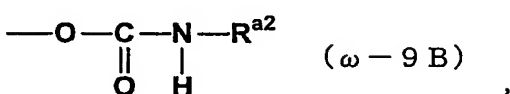
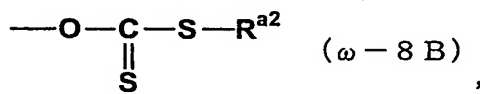
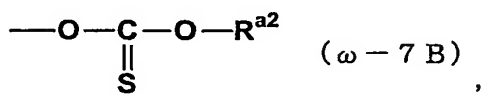
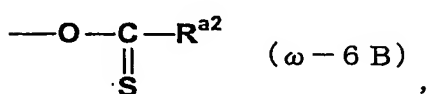
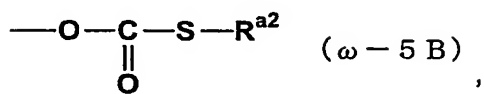
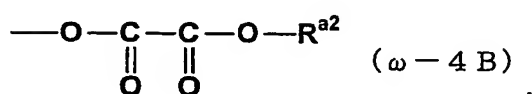
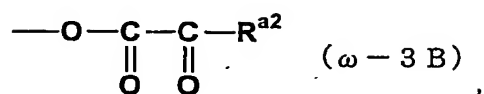
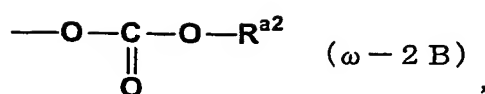
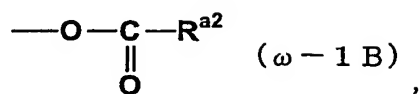
本明細書において、ある官能基について「置換基を有していてもよい」という場合には、特に言及する場合を除き、その官能基が、化学的に可能な位置に1個又は2個以上の「置換基」を有する場合があることを意味する。官能基に存在する置換基の種類、置換基の個数、及び置換位置は特に限定されず、2個以上の置換基が存在する場合には、それらは同一であっても異なってもよい。官能基に存在する「置換基」としては、例えば、ハロゲン原子、オキシ基、チオキシ基、ニトロ基、ニトロソ基、シアノ基、イソシアノ基、シアナト基、チオシアナト基、イソシアナト基、イソチオシアナト基、ヒドロキシ基、スルファニル基、カルボキシ基、スルファニルカルボニル基、オキサロ基、メソオキサロ基、チオカルボキシ基、ジチオカルボキシ基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、スルホ基、スルファモイル基、スルフィノ基、スルフィナモイル基、スルフェノ基、スルフェナモイル基、ホスホノ基、ヒドロキシホスホニル基、炭化水素基、ヘテロ環基、炭化水素-オキシ基、ヘテロ環-オキシ基、炭化水素-スルファニル基、ヘテロ環-スルファニル基、アシル基、アミノ基、ヒドラジノ基、ヒドラゾノ基、ジアゼニル基、ウレイド基、チオウレイド基、グアニジノ基、カルバモイミドイル基（アミジノ基）、アジド基、イミノ基、ヒドロキシアミノ基、ヒドロキシイミノ基、アミノオキシ基、ジアゾ基、セミカルバジノ基、セミカルバゾノ基、アロファニル基、ヒダントイル基、ホスファノ基、ホスホロソ基、ホスホ基、ボリル基、シリル基、スタニル基、セラニル基、オキシド基等を挙げることができる。

上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」が2個以上存在する場合、該2個以上の置換基は、それらが結合している原子と一緒になって環式基を形成してもよい。該環上には1個以上の置換基が存在していてもよい。該環は、単環式又は縮合多環式のいずれであってもよく、芳香族又は非芳香族のい

ずれであってもよい。

上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」は、該置換基上の化学的に可能な位置で、上記「置換基」によって置換されていてもよい。置換基の種類、置換基の個数、及び置換位置は特に限定されず、2個以上の置換基で置換される場合には、それらは同一であっても異なってもよい。そのような例として、例えば、ハロゲン化アルキル-カルボニル基（例えば、トリフルオロアセチル等の基）、ハロゲン化アルキル-スルホニル基（例えば、トリフルオロメタンスルホニル等の基）、アシル-オキシ基、アシル-スルファニル基、N-炭化水素基-アミノ基、N, N-ジ（炭化水素）-アミノ基、N-ヘテロ環-アミノ基、N-炭化水素-N-ヘテロ環-アミノ基、アシル-アミノ基、ジ（アシル）-アミノ基等の基が挙げられる。又、上記「置換基」にはさらに任意の置換基が1個または2個以上存在していてもよい。

「アシル-オキシ基」としては、「ヒドロキシ基」の水素原子が「アシル基」で置換された基が挙げられ、例えば、ホルミルオキシ基、グリオキシロイルオキシ基、チオホルミルオキシ基、及び下記式：



(式中、 R^{a2} 及び R^{b2} はそれぞれ独立に炭化水素基又はヘテロ環基を表すが、 R^{a2} 及び R^{b2} が同一の窒素原子に結合する場合には、 R^{a2} 及び R^{b2} が一緒になっ

て、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成してもよい) で表される基が挙げられる。

上記「アシルーオキシ基」の定義において、

式 ($\omega-1$ B) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素ーカルボニルーオキシ基」(具体例: アセトキシ、ベンゾイルオキシ等の基)、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルーオキシ基」と称する。

式 ($\omega-2$ B) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーオキシ基」と称する。

式 ($\omega-3$ B) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素ーカルボニルーカルボニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルーカルボニルーオキシ基」と称する。

式 ($\omega-4$ B) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルーカルボニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーカルボニルーオキシ基」と称する。

式 ($\omega-5$ B) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素ースルファニルーカルボニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーカルボニルーオキシ基」と称する。

式 ($\omega-6$ B) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素ーチオカルボニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーチオカルボニルーオキシ基」と称する。

式 ($\omega-7$ B) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーチオカルボニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーチオカルボニルーオキシ基」と称する。

式 ($\omega-8$ B) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素ースルファニルーチオカルボニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーチオカルボニルーオキシ基」と称する。

式(ω-9B)で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-カルバモイル-オキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-カルバモイル-オキシ基」と称する。

式(ω-10B)で表される基の中で、 R^{a2} 及び R^{b2} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-カルバモイル-オキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-カルバモイル-オキシ基」、 R^{a2} が炭化水素基であり R^{b2} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-カルバモイル-オキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「環状アミノ-カルボニル-オキシ基」と称する。

式(ω-11B)で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-チオカルバモイル-オキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-チオカルバモイル-オキシ基」と称する。

式(ω-12B)で表される基の中で、 R^{a2} 及び R^{b2} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-チオカルバモイル-オキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-チオカルバモイル-オキシ基」、 R^{a2} が炭化水素基であり R^{b2} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-チオカルバモイル-オキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「環状アミノ-チオカルボニル-オキシ基」と称する。

式(ω-13B)で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルファモイル-オキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルファモイル-オキシ基」と称する。

式(ω-14B)で表される基の中で、 R^{a2} 及び R^{b2} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-スルファモイル-オキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-スルファモイル-オキシ基」、 R^{a2} が炭化水素基であり R^{b2} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-ス

ルファモイルーオキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「環状アミノスルホニルーオキシ基」と称する。

式($\omega-15B$)で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルフィナモイルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルフィナモイルーオキシ基」と称する。

式($\omega-16B$)で表される基の中で、 R^{a2} 及び R^{b2} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-スルフィナモイルーオキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-スルフィナモイルーオキシ基」、 R^{a2} が炭化水素基であり R^{b2} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルフィナモイルーオキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「環状アミノスルフィニルーオキシ基」と称する。

式($\omega-17B$)で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルホニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルホニルーオキシ基」と称する。

式($\omega-18B$)で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルフィニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルフィニルーオキシ基」と称する。

式($\omega-19B$)で表される基の中で、 R^{a2} 及び R^{b2} が炭化水素基である基を「O, O'-ジ(炭化水素)-ホスホノーオキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} がヘテロ環基である基を「O, O'-ジ(ヘテロ環)-ホスホノーオキシ基」、 R^{a2} が炭化水素基であり R^{b2} がヘテロ環基である基を「O-炭化水素置換-O'-ヘテロ環置換ホスホノーオキシ基」と称する。

式($\omega-20B$)で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素-スルホニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルホニルーオキシ基」と称する。

式 ($\omega-21B$) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素—スルフィニル—オキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環—スルフィニル—オキシ基」と称する。

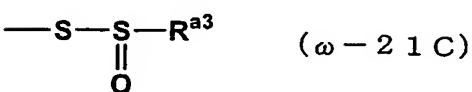
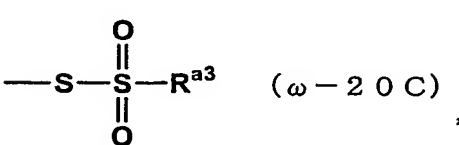
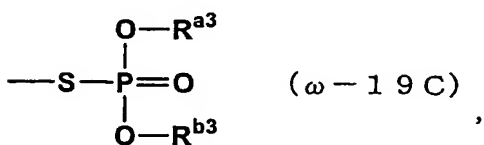
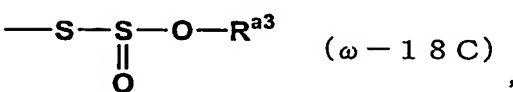
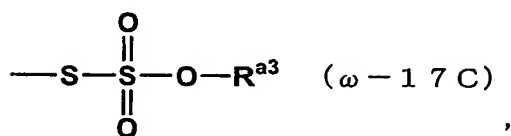
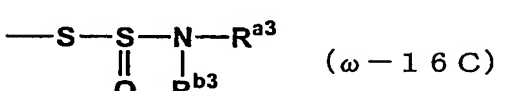
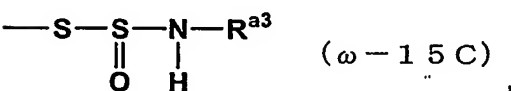
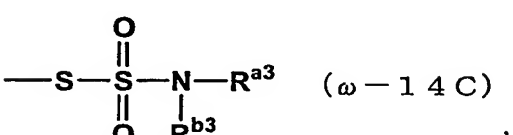
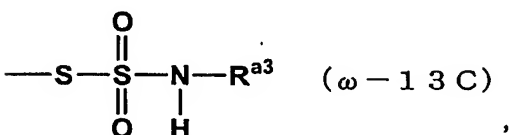
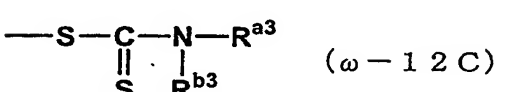
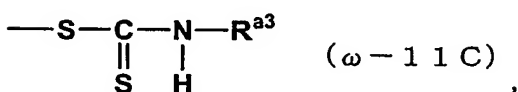
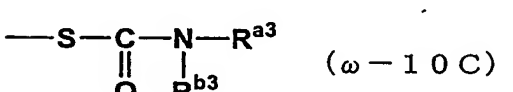
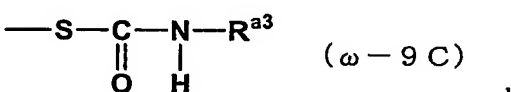
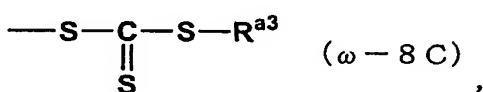
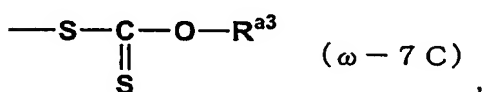
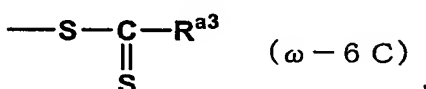
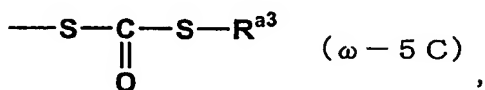
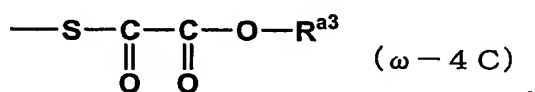
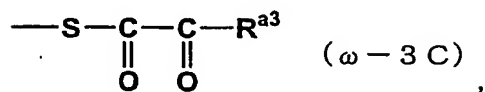
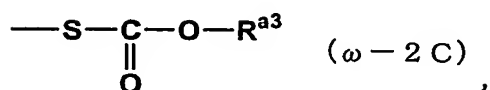
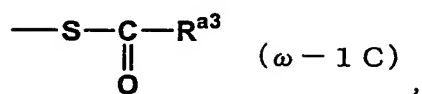
上記式 ($\omega-1B$) ないし ($\omega-21B$) で表される基における「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ($\omega-1B$) で表される「炭化水素—カルボニル—オキシ基」としては、アルキル—カルボニル—オキシ基、アルケニル—カルボニル—オキシ基、アルキニル—カルボニル—オキシ基、シクロアルキル—カルボニル—オキシ基、シクロアルケニル—カルボニル—オキシ基、シクロアルカンジエニル—カルボニル—オキシ基、シクロアルキル—アルキル—カルボニル—オキシ基等の脂肪族炭化水素—カルボニル—オキシ基；アリール—カルボニル—オキシ基；アラルキル—カルボニル—オキシ基；架橋環式炭化水素—カルボニル—オキシ基；スピロ環式炭化水素—カルボニル—オキシ基；テルペン系炭化水素—カルボニル—オキシ基が挙げられる。以下、式 ($\omega-2B$) ないし ($\omega-21B$) で表される基も同様である。

上記式 ($\omega-1B$) ないし ($\omega-21B$) で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ($\omega-1B$) で表される「ヘテロ環—カルボニル基」としては、例えば、単環式ヘテロアリール—カルボニル基、縮合多環式ヘテロアリール—カルボニル基、単環式非芳香族ヘテロ環—カルボニル基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環—カルボニル基が挙げられる。以下、式 ($\omega-2B$) ないし ($\omega-21B$) で表される基も同様である。上記式 ($\omega-10B$) ないし ($\omega-16B$) で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

上記「アシル—オキシ基」、「炭化水素—オキシ基」、及び「ヘテロ環—オキシ基」を総称して、「置換オキシ基」と称する。又、これら「置換オキシ基」と「ヒドロキシ基」を総称して、「置換基を有していてもよいヒドロキシ基」と称する。

「アシル—スルファニル基」としては、「スルファニル基」の水素原子が「アシル基」で置換された基が挙げられ、例えば、ホルミルスルファニル基、グリオキ

シロイルスルファニル基、チオホルミルスルファニル基、及び下記式：



(式中、 R^{a3} 及び R^{b3} はそれぞれ独立に置換基を有していてもよい炭化水素基、又は置換基を有していてもよいヘテロ環基を示すが、 R^{a3} 及び R^{b3} が同一の窒素原子に結合する場合には、 R^{a3} 及び R^{b3} が一緒になってそれらが結合している窒素原子と共に置換基を有していてもよい環状アミノ基を形成してもよい) で表される基が挙げられる。

上記「アシルースルファニル基」の定義において、式($\omega-1C$)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素ーカルボニルースルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルースルファニル基」と称する。

式($\omega-2C$)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルースルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルースルファニル基」と称する。

式($\omega-3C$)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素ーカルボニルーカルボニルースルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルーカルボニルースルファニル基」と称する。

式($\omega-4C$)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルーカルボニルースルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーカルボニルースルファニル基」と称する。

式($\omega-5C$)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素ースルファニルーカルボニルースルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーカルボニルースルファニル基」と称する。

式($\omega-6C$)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素ーチオカルボニルースルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーチオカルボニルースルファニル基」と称する。

式($\omega-7C$)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーチオカルボニルースルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーチオカルボニルースルファニル基」と称する。

式(ω-8C)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素-スルファニル-チオカルボニル-スルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルファニル-チオカルボニル-スルファニル基」と称する。

式(ω-9C)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-カルバモイル-スルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-カルバモイル-スルファニル基」と称する。

式(ω-10C)で表される基の中で、 R^{a3} 及び R^{b3} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-カルバモイル-スルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-カルバモイル-スルファニル基」、 R^{a3} が炭化水素基であり R^{b3} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-カルバモイル-スルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「環状アミノ-カルボニル-スルファモイル基」と称する。

式(ω-11C)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-チオカルバモイル-スルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-チオカルバモイル-スルファニル基」と称する。

式(ω-12C)で表される基の中で、 R^{a3} 及び R^{b3} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-チオカルバモイル-スルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-チオカルバモイル-スルファニル基」、 R^{a3} が炭化水素基であり R^{b3} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-チオカルバモイル-スルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「環状アミノ-チオカルボニル-スルファニル基」と称する。

式(ω-13C)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルファモイル-スルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルファモイル-スルファニル基」と称する。

式(ω-14C)で表される基の中で、 R^{a3} 及び R^{b3} が炭化水素基である基を「N,

N-ジ（炭化水素）-スルファモイル-スルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ（ヘテロ環）-スルファモイル-スルフィニル基」、 R^{a3} が炭化水素基であり R^{b3} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環スルファモイル-スルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「環状アミノ-スルホニル-スルファニル基」と称する。

式（ $\omega-15C$ ）で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルフィナモイル-スルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルフィナモイル-スルファニル基」と称する。

式（ $\omega-16C$ ）で表される基の中で、 R^{a3} 及び R^{b3} が炭化水素基である基を「N, N-ジ（炭化水素）-スルフィナモイル-スルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ（ヘテロ環）-スルフィナモイル-スルファニル基」、 R^{a3} が炭化水素基であり R^{b3} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルフィナモイル-スルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「環状アミノ-スルファニル-スルファニル基」と称する。

式（ $\omega-17C$ ）で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルホニル-スルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルホニル-スルファニル基」と称する。

式（ $\omega-18C$ ）で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルフィニル-スルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルフィニル-スルファニル基」と称する。

式（ $\omega-19C$ ）で表される基の中で、 R^{a3} 及び R^{b3} が炭化水素基である基を「O, O'-ジ（炭化水素）-ホスホノ-スルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} がヘテロ環基である基を「O, O'-ジ（ヘテロ環）-ホスホノ-スルファニル基」、 R^{a3} が炭化水素基であり R^{b3} がヘテロ環基である基を「O-炭化水素-O'-ヘテロ環-ホスホノ-スルファニル基」と称する。

式 ($\omega-20C$) で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素—スルホニル—スルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環—スルホニル—スルファニル基」と称する。

式 ($\omega-21C$) で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素—スルフィニル—スルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環—スルフィニル—スルファニル基」と称する。

上記式 ($\omega-1C$) ないし ($\omega-21C$) で表される基における「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ($\omega-1C$) で表される「炭化水素—カルボニル—スルファニル基」としては、アルキル—カルボニル—スルファニル基、アルケニル—カルボニル—スルファニル基、アルキニル—カルボニル—スルファニル基、シクロアルキル—カルボニル—スルファニル基、シクロアルケニル—カルボニル—スルファニル基、シクロアルカンジエニル—カルボニル—スルファニル基、シクロアルキル—アルキル—カルボニル—スルファニル基等の脂肪族炭化水素—カルボニル—スルファニル基；アリール—カルボニル—スルファニル基；アラルキル—カルボニル—スルファニル基；架橋環式炭化水素—カルボニル—スルファニル基；スピロ環式炭化水素—カルボニル—スルファニル基；テルペン系炭化水素—カルボニル—スルファニル基が挙げられる。以下、式 ($\omega-2C$) ないし ($\omega-21C$) で表される基も同様である。

上記式 ($\omega-1C$) ないし ($\omega-21C$) で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ($\omega-1C$) で表される「ヘテロ環—カルボニル—スルファニル基」としては、例えば、単環式ヘテロアリール—カルボニル—スルファニル基、縮合多環式ヘテロアリール—カルボニル—スルファニル基、単環式非芳香族ヘテロ環—カルボニル—スルファニル基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環—カルボニル—スルファニル基が挙げられる。以下、式 ($\omega-2C$) ないし ($\omega-21C$) で表される基も同様である。

上記式 ($\omega-10C$) ないし ($\omega-16C$) で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

上記「アシルースルファニル基」、「炭化水素ースルファニル基」、及び「ヘテロ環ースルファニル基」を総称して、「置換スルファニル基」と称する。又、これら「置換スルファニル基」と「スルファニル基」を総称して、「置換基を有していてもよいスルファニル基」と称する。

「Nー炭化水素ーアミノ基」としては、「アミノ基」の1つの水素原子が、「炭化水素基」で置換された基が挙げられ、例えば、Nーアルキルーアミノ基、Nーアルケニルーアミノ基、Nーアルキニルーアミノ基、Nーシクロアルキルーアミノ基、Nーシクロアルキルーアルキルーアミノ基、Nーアリールーアミノ基、Nーアラルキルーアミノ基等が挙げられる。

「Nーアルキルーアミノ基」としては、例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、nープロピルアミノ、イソプロピルアミノ、nーブチルアミノ、イソブチルアミノ、secーブチルアミノ、tertーブチルアミノ、nーペンチルアミノ、イソペンチルアミノ、(2ーメチルブチル)アミノ、(1ーメチルブチル)アミノ、ネオペンチルアミノ、(1, 2ージメチルプロピル)アミノ、(1ーエチルプロピル)アミノ、nーヘキシルアミノ、(4ーメチルペンチル)アミノ、(3ーメチルペンチル)アミノ、(2ーメチルペンチル)アミノ、(1ーメチルペンチル)アミノ、(3, 3ージメチルブチル)アミノ、(2, 2ージメチルブチル)アミノ、(1, 1ージメチルブチル)アミノ、(1, 2ージメチルブチル)アミノ、(1, 3ージメチルブチル)アミノ、(2, 3ージメチルブチル)アミノ、(2ーエチルブチル)アミノ、(1ーエチルブチル)アミノ、(1ーエチルー1ーメチルプロピル)アミノ、nーヘプチルアミノ、nーオクチルアミノ、nーノニルアミノ、nーデシルアミノ、nーウンデシルアミノ、nードデシルアミノ、nートリデシルアミノ、nーテトラデシルアミノ、nーペンタデシルアミノ等のC₁~C₁₅の直鎖状又は分枝鎖状のNーアルキルーアミノ基が挙げられる。

「Nーアルケニルーアミノ基」としては、例えば、ビニルアミノ、(プロパー1ーエンー1ーイル)アミノ、アリルアミノ、イソプロペニルアミノ、(ブター1ーエンー1ーイル)アミノ、(ブター2ーエンー1ーイル)アミノ、(ブター3ーエ

ン-1-イル) アミノ、(2-メチルプロパー2-エン-1-イル) アミノ、(1-メチルプロパー2-エン-1-イル) アミノ、(ペンタ-1-エン-1-イル) アミノ、(ペンタ-2-エン-1-イル) アミノ、(ペンタ-3-エン-1-イル) アミノ、(ペンタ-4-エン-1-イル) アミノ、(3-メチルブター2-エン-1-イル) アミノ、(3-メチルブター3-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-1-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-2-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-3-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-4-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-5-エン-1-イル) アミノ、(4-メチルペンタ-3-エン-1-イル) アミノ、(4-メチルペンタ-3-エン-1-イル) アミノ、(ヘプター1-エン-1-イル) アミノ、(ヘプター6-エン-1-イル) アミノ、(オクター1-エン-1-イル) アミノ、(オクター7-エン-1-イル) アミノ、(ノナ-1-エン-1-イル) アミノ、(ノナ-8-エン-1-イル) アミノ、(デカー1-エン-1-イル) アミノ、(デカー9-エン-1-イル) アミノ、(ウンデカー1-エン-1-イル) アミノ、(ウンデカー10-エン-1-イル) アミノ、(ドデカー1-エン-1-イル) アミノ、(ドデカー11-エン-1-イル) アミノ、(トリデカー1-エン-1-イル) アミノ、(トリデカー12-エン-1-イル) アミノ、(テトラデカー1-エン-1-イル) アミノ、(テトラデカー13-エン-1-イル) アミノ、(ペンタデカー1-エン-1-イル) アミノ、(ペンタデカー14-エン-1-イル) アミノ等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のN-アルケニル-アミノ基が挙げられる。

「N-アルキニル-アミノ基」としては、例えば、エチニルアミノ、(プロパー1-イン-1-イル) アミノ、(プロパー2-イン-1-イル) アミノ、(ブター1-イン-1-イル) アミノ、(ブター3-イン-1-イル) アミノ、(1-メチルプロパー2-イン-1-イル) アミノ、(ペンタ-1-イン-1-イル) アミノ、(ペンタ-4-イン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-1-イン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-5-イン-1-イル) アミノ、(ヘプター1-イン-1-イル、(ヘプター6-イン-1-イル) アミノ、(オクター1-イン-1-イル) アミノ、(オ

クター7-イン-1-イル) アミノ、(ノナ-1-イン-1-イル) アミノ、(ノナ-8-イン-1-イル) アミノ、(デカ-1-イン-1-イル) アミノ、(デカ-9-イン-1-イル) アミノ、(ウンデカ-1-イン-1-イル) アミノ、(ウンデカ-10-イン-1-イル) アミノ、(ドデカ-1-イン-1-イル) アミノ、(ドデカ-11-イン-1-イル) アミノ、(トリデカ-1-イン-1-イル) アミノ、(トリデカ-12-イン-1-イル) アミノ、(テトラデカ-1-イン-1-イル) アミノ、(テトラデカ-13-イン-1-イル) アミノ、(ペンタデカ-1-イン-1-イル) アミノ、(ペンタデカ-14-イン-1-イル) アミノ等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のN-アルキル-アミノ基が挙げられる。

「N-シクロアルキル-アミノ基」としては、例えば、シクロプロピルアミノ、シクロブチルアミノ、シクロペンチルアミノ、シクロヘキシルアミノ、シクロヘプチルアミノ、シクロオクチルアミノ等の $C_3 \sim C_8$ のN-シクロアルキル-アミノ基が挙げられる。

「N-シクロアルキル-アルキル-アミノ基」としては、例えば、(シクロプロピルメチル) アミノ、(1-シクロプロピルエチル) アミノ、(2-シクロプロピルエチル) アミノ、(3-シクロプロピルプロピル) アミノ、(4-シクロプロピルブチル) アミノ、(5-シクロプロピルペンチル) アミノ、(6-シクロプロピルヘキシル) アミノ、(シクロブチルメチル) アミノ、(シクロペンチルメチル) アミノ、(シクロブチルメチル) アミノ、(シクロペンチルメチル) アミノ、(シクロヘキシルメチル) アミノ、(2-シクロヘキシルエチル) アミノ、(3-シクロヘキシルプロピル) アミノ、(4-シクロヘキシルブチル) アミノ、(シクロヘプチルメチル) アミノ、(シクロオクチルメチル) アミノ、(6-シクロオクチルヘキシル) アミノ等の $C_4 \sim C_{14}$ のN-シクロアルキル-アルキル-アミノ基が挙げられる。

「N-アリール-アミノ基」としては、例えば、フェニルアミノ、1-ナフチルアミノ、2-ナフチルアミノ、アントリルアミノ、フェナントリルアミノ、アセナフチレニルアミノ等の $C_6 \sim C_{14}$ のN-モノ-アリールアミノ基が挙げられ

る。

「N-アラルキル-アミノ基」としては、例えば、ベンジルアミノ、(1-ナフチルメチル)アミノ、(2-ナフチルメチル)アミノ、(アントラセニルメチル)アミノ、(フェナントレニルメチル)アミノ、(アセナフチレニルメチル)アミノ、(ジフェニルメチル)アミノ、(1-フェネチル)アミノ、(2-フェネチル)アミノ、(1-(1-ナフチル)エチル)アミノ、(1-(2-ナフチル)エチル)アミノ、(2-(1-ナフチル)エチル)アミノ、(2-(2-ナフチル)エチル)アミノ、(3-フェニルプロピル)アミノ、(3-(1-ナフチル)プロピル)アミノ、(3-(2-ナフチル)プロピル)アミノ、(4-フェニルブチル)アミノ、(4-(1-ナフチル)ブチル)アミノ、(4-(2-ナフチル)ブチル)アミノ、(5-フェニルペンチル)アミノ、(5-(1-ナフチル)ペンチル)アミノ、(5-(2-ナフチル)ペンチル)アミノ、(6-フェニルヘキシル)アミノ、(6-(1-ナフチル)ヘキシル)アミノ、(6-(2-ナフチル)ヘキシル)アミノ等のC₇~C₁₆のN-アラルキル-アミノ基が挙げられる。

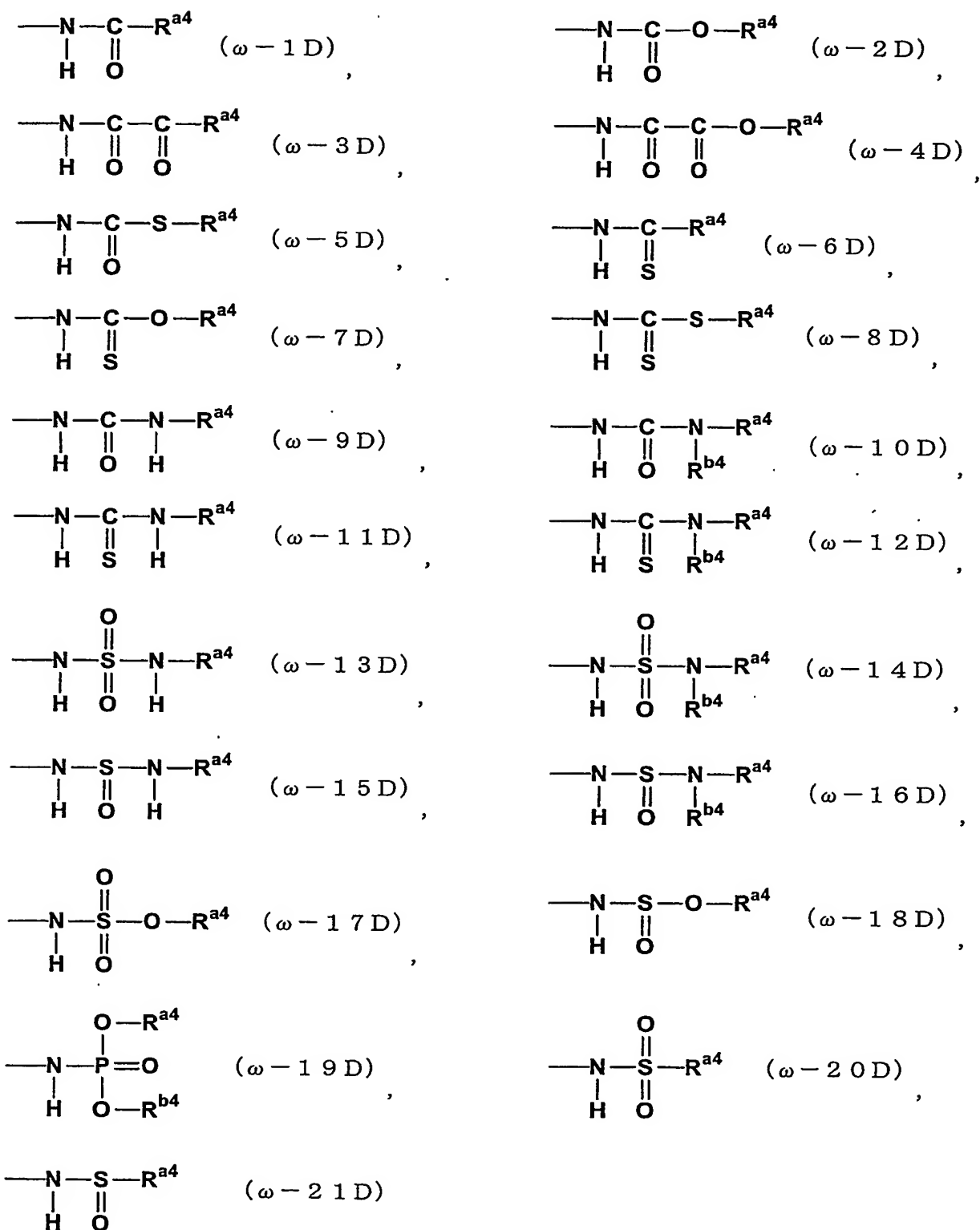
「N, N-ジ(炭化水素)-アミノ基」としては、「アミノ基」の2つの水素原子が、「炭化水素基」で置換された基が挙げられ、例えば、N, N-ジメチルアミノ、N, N-ジエチルアミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、N, N-ジ-n-プロピルアミノ、N, N-ジイソプロピルアミノ、N-アリル-N-メチルアミノ、N-(プロパー2-イン-1-イル)-N-メチルアミノ、N, N-ジシクロヘキシルアミノ、N-シクロヘキシル-N-メチルアミノ、N-シクロヘキシルメチルアミノ-N-メチルアミノ、N, N-ジフェニルアミノ、N-メチル-N-フェニルアミノ、N, N-ジベンジルアミノ、N-ベンジル-N-メチルアミノ等の基が挙げられる。

「N-ヘテロ環-アミノ基」としては、「アミノ基」の1つ水素原子が、「ヘテロ環基」で置換された基が挙げられ、例えば、(3-ピロリジニル)アミノ、(4-ピペリジニル)アミノ、(2-テトラヒドロピラニル)アミノ、(3-インドリニル)アミノ、(4-クロマニル)アミノ、(3-チエニル)アミノ、(3-ピリジ

ル) アミノ、(3-キノリル) アミノ、(5-インドリル) アミノ等の基が挙げられる。

「N-炭化水素-N-ヘテロ環-アミノ基」としては、「アミノ基」の2つの水素原子が、「炭化水素基」及び「ヘテロ環基」で1つずつ置換された基が挙げられ、例えば、N-メチル-N-(4-ピペリジニル) アミノ、N-(4-クロマニル)-N-メチルアミノ、N-メチル-N-(3-チエニル) アミノ、N-メチル-N-(3-ピリジル) アミノ、N-メチル-N-(3-キノリル) アミノ等の基が挙げられる。

「アシル-アミノ基」としては、「アミノ基」の1つの水素原子が、「アシル基」で置換された基が挙げられ、例えば、ホルミルアミノ基、グリオキシロイルアミノ基、チオホルミルアミノ基、及び下記式：



(式中、 R^{a4} 及び R^{b4} はそれぞれ独立に置換基を有していてもよい炭化水素基、

又は置換基を有していてもよいヘテロ環基を示すが、 R^{a4} 及び R^{b4} が同一の窒素原子に結合する場合には、 R^{a4} 及び R^{b4} は一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に置換基を有していてもよい環状アミノ基を形成してもよい)で表される基が挙げられる。

上記「アシルーアミノ基」の定義において、

式($\omega-1D$)で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素ーカルボニルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルーアミノ基」と称する。

式($\omega-2D$)で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーアミノ基」と称する。

式($\omega-3D$)で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素ーカルボニルーカルボニルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルーカルボニルーアミノ基」と称する。

式($\omega-4D$)で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルーカルボニルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーカルボニルーアミノ基」と称する。

式($\omega-5D$)で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素ースルファニルーカルボニルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーカルボニルーアミノ基」と称する。

式($\omega-6D$)で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素ーチオカルボニルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーチオカルボニルーアミノ基」と称する。

式($\omega-7D$)で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーチオカルボニルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーチオカルボニルーアミノ基」と称する。

式($\omega-8D$)で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素ー

スルファニルーチオカルボニルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルファニルーチオカルボニルーアミノ基」と称する。

式($\omega-9D$)で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-カルバモイル基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-カルバモイル-アミノ基」と称する。

式($\omega-10D$)で表される基の中で、 R^{a4} 及び R^{b4} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-カルバモイル-アミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-カルバモイル-アミノ基」、 R^{a4} が炭化水素基であり R^{b4} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-カルバモイル-アミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「環状アミノ-カルボニルーアミノ基」と称する。

式($\omega-11D$)で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-チオカルバモイル-アミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-チオカルバモイル-アミノ基」と称する。

式($\omega-12D$)で表される基の中で、 R^{a4} 及び R^{b4} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-チオカルバモイル-アミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-チオカルバモイル-アミノ基」、 R^{a4} が炭化水素基であり R^{b4} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-チオカルバモイル-アミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「環状アミノ-チオカルボニルーアミノ基」と称する。

式($\omega-13D$)で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルファモイル-アミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルファモイル-アミノ基」と称する。

式($\omega-14D$)で表される基の中で、 R^{a4} 及び R^{b4} が炭化水素基である基を「ジ(炭化水素)スルファモイル-アミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} がヘテロ環基である基

を「N, N-ジ (ヘテロ環) スルファモイル-アミノ基」、 R^{a4} が炭化水素基であり R^{b4} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルファモイル-アミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「環状アミノ-スルホニル-アミノ基」と称する。

式 ($\omega-15D$) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルフィナモイル-アミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルフィナモイル-アミノ基」と称する。; 式 ($\omega-16D$) で表される基の中で、 R^{a4} 及び R^{b4} が炭化水素基である基を「N, N-ジ (炭化水素) -スルフィナモイル-アミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ (ヘテロ環) -スルフィナモイル-アミノ基」、 R^{a4} が炭化水素基であり R^{b4} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルフィナモイル-アミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「環状アミノ-スルフィニル-アミノ基」と称する。

式 ($\omega-17D$) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルホニル-アミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルホニル-アミノ基」と称する。

式 ($\omega-18D$) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルフィニル-アミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルフィニル-アミノ基」と称する。

式 ($\omega-19D$) で表される基の中で、 R^{a4} 及び R^{b4} が炭化水素基である基を「O, O'-ジ (炭化水素) -ホスホノ-アミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} がヘテロ環基である基を「O, O'-ジ (ヘテロ環) -ホスホノ-アミノ基」、 R^{a4} が炭化水素基であり R^{b4} がヘテロ環基である基を「O-炭化水素-O'-ヘテロ環-ホスホノ-アミノ基」と称する。

式 ($\omega-20D$) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素-スルホニル-アミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルホニ

ルアミノ基」と称する。

式 ($\omega-21D$) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素-スルフィニルアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルフィニルアミノ基」と称する。

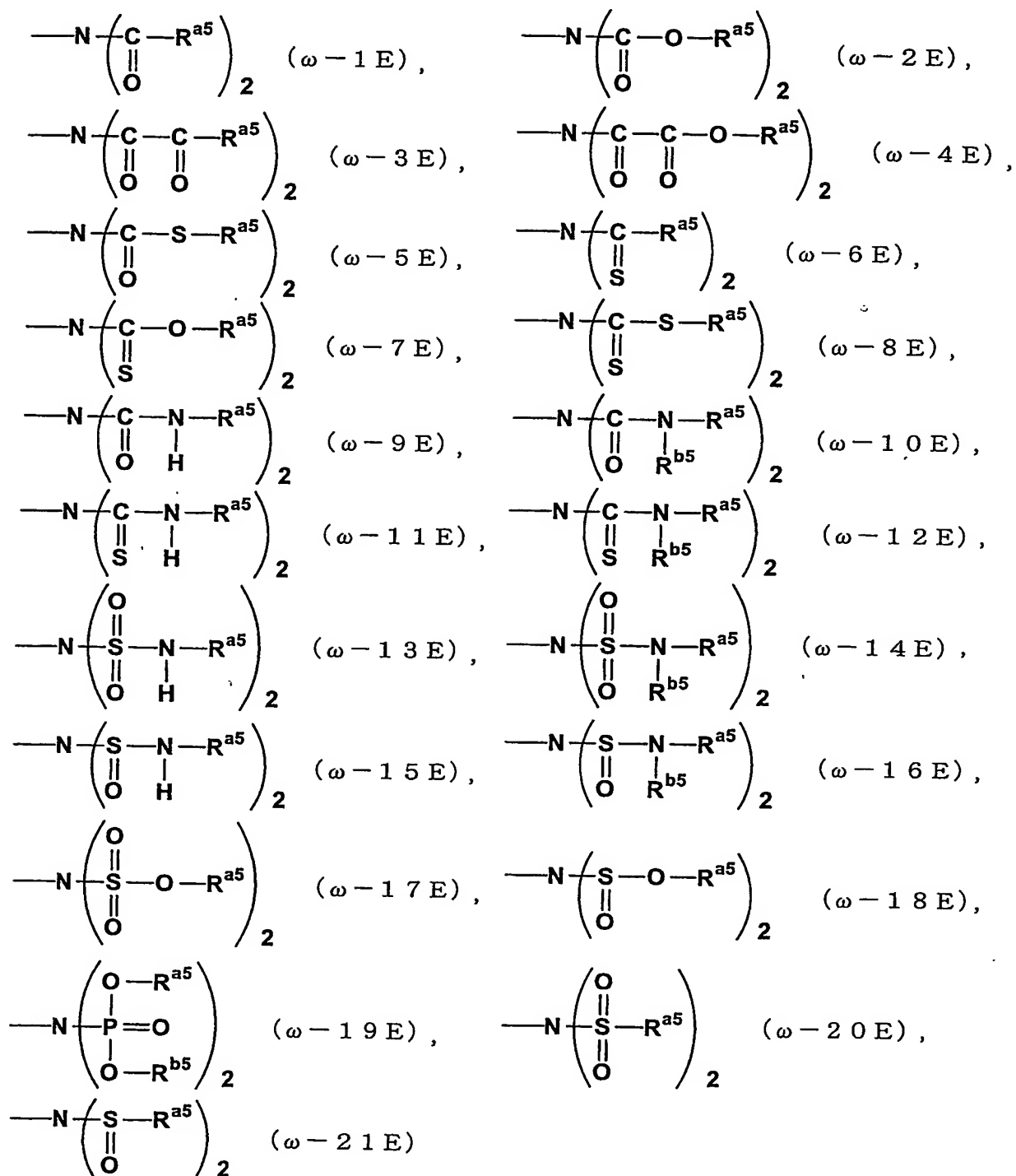
上記式 ($\omega-1D$) ないし ($\omega-21D$) で表される基における「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ($\omega-1D$) で表される「炭化水素-カルボニルアミノ基」としては、アルキル-カルボニルアミノ基、アルケニル-カルボニルアミノ基、アルキニル-カルボニルアミノ基、シクロアルキル-カルボニルアミノ基、シクロアルケニル-カルボニルアミノ基、シクロアルカンジエニル-カルボニルアミノ基、シクロアルキル-アルキル-カルボニルアミノ基等の脂肪族炭化水素-カルボニルアミノ基；アリール-カルボニルアミノ基；アラルキル-カルボニルアミノ基；架橋環式炭化水素-カルボニルアミノ基；スピロ環式炭化水素-カルボニルアミノ基；テルペン系炭化水素-カルボニルアミノ基が挙げられる。以下、式 ($\omega-2D$) ないし ($\omega-21D$) で表される基も同様である。

上記式 ($\omega-1D$) ないし ($\omega-21D$) で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ($\omega-1D$) で表される「ヘテロ環-カルボニルアミノ基」としては、例えば、単環式ヘテロアリール-カルボニルアミノ基、縮合多環式ヘテロアリール-カルボニルアミノ基、単環式非芳香族ヘテロ環-カルボニルアミノ基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環-カルボニルアミノ基が挙げられる。以下、式 ($\omega-2D$) ないし ($\omega-21D$) で表される基も同様である。

上記式 ($\omega-10D$) ないし ($\omega-16D$) で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

「ジ(アシル)-アミノ基」としては、「アミノ基」の2つの水素原子が、上記「置換基を有していてもよい」の「置換基」の定義における「アシル基」で置換された基が挙げられ、例えば、ジ(ホルミル)-アミノ基、ジ(グリオキシロイ

ル) -アミノ基、ジ (チオホルミル) -アミノ基、及び下記式：



(式中、 $\text{R}^{\text{a}5}$ 及び $\text{R}^{\text{b}5}$ はそれぞれ独立に水素原子、置換基を有していてもよい炭

化水素基、又は置換基を有していてもよいヘテロ環基を表すが、 R^{a5} 及び R^{b5} が同一の窒素原子に結合する場合には、 R^{a5} 及び R^{b5} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に置換基を有していてもよい環状アミノ基を形成してもよい) で表される基があげられる。

上記「ジ (アシル) -アミノ基」の定義において、

式 ($\omega-1E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素-カルボニル) -アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環-カルボニル) -アミノ基」と称する。

式 ($\omega-2E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素-オキシカルボニル) -アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環-オキシカルボニル) -アミノ基」と称する。

式 ($\omega-3E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素-カルボニル-カルボニル) -アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環-カルボニル-カルボニル) -アミノ基」と称する。

式 ($\omega-4E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素-オキシカルボニル-カルボニル) -アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環-オキシカルボニル-カルボニル) -アミノ基」と称する。

式 ($\omega-5E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素-スルファニル-カルボニル) -アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環-スルファニル-カルボニル) -アミノ基」と称する。

式 ($\omega-6E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素-チオカルボニル) -アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環-チオカルボニル) -アミノ基」と称する。

式 ($\omega-7E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素-オキシチオカルボニル) -アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環-オキシチオカルボニル) -アミノ基」と称する。

式 ($\omega-8E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素

ースルファニルーチオカルボニル)ーアミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環ースルファニルーチオカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-9E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (Nー炭化水素ーカルバモイル) アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (Nーヘテロ環ーカルバモイル)ーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-10E$) で表される基で、 R^{a5} 及び R^{b5} が炭化水素基である基を「ビス [N, Nージ (炭化水素)ーカルバモイル]ーアミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス [N, Nージ (ヘテロ環)ーカルバモイル]ーアミノ基」、 R^{a5} が炭化水素基であり R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス (Nー炭化水素ーNーヘテロ環ーカルバモイル)ーアミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「ビス (環状アミノーカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-11E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (Nー炭化水素ーチオカルバモイル)ーアミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (Nーヘテロ環ーチオカルバモイル)ーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-12E$) で表される基で、 R^{a5} 及び R^{b5} が炭化水素基である基を「ビス [N, Nージ (炭化水素)ーチオカルバモイル]ーアミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス [N, Nージ (ヘテロ環)ーチオカルバモイル]ーアミノ基」、 R^{a5} が炭化水素基であり R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス (Nー炭化水素ーNーヘテロ環ーチオカルバモイル)ーアミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「ビス (環状アミノーチオカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-13E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (Nー炭化水素ースルファモイル)ーアミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (Nーヘテロ環ースルファモイル)ーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-14E$) で表される基で、 R^{a5} 及び R^{b5} が炭化水素基である基を「ビス [N, Nージ (炭化水素)ースルファモイル]ーアミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} がヘ

テロ環基である基を「ビス [N, N-ジ (ヘテロ環) -スルファモイル] -アミノ基」、 R^{a5} が炭化水素基であり R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス (N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルファモイル) -アミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「ビス (環状アミノ-スルホニル) -アミノ基」と称する。

式 ($\omega-15E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (N-炭化水素-スルフィナモイル) -アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (N-ヘテロ環-スルフィナモイル) -アミノ基」と称する。

式 ($\omega-16E$) で表される基で、 R^{a5} 及び R^{b5} が炭化水素基である基を「ビス [N, N-ジ (炭化水素) -スルフィナモイル] -アミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス [N, N-ジ (ヘテロ環) -スルフィナモイル] -アミノ基」、 R^{a5} が炭化水素基であり R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス (N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルフィナモイル) -アミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を形成した基を「ビス (環状アミノ-スルフィニル) -アミノ基」と称する。

式 ($\omega-17E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素-オキシ-スルホニル) -アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環-オキシ-スルホニル) -アミノ基」と称する。

式 ($\omega-18E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素-オキシ-スルフィニル) -アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環-オキシ-スルフィニル) -アミノ基」と称する。

式 ($\omega-19E$) で表される基で、 R^{a5} 及び R^{b5} が炭化水素基である基を「ビス [O, O'-ジ (炭化水素) -ホスホノ] -アミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス [O, O'-ジ (ヘテロ環) -ホスホノ] -アミノ基」、 R^{a5} が炭化水素基であり R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス (O-炭化水素-O'-ヘテロ環-ホスホノ) -アミノ基」と称する。

式 ($\omega-20E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水

素－スルホニル)－アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環－スルホニル)－アミノ基」と称する。

式 ($\omega-21E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素－スルフィニル)－アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環－スルフィニル)－アミノ基」と称する。

上記式 ($\omega-1E$) ないし ($\omega-21E$) で表される基における「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ($\omega-1E$) で表される「ビス (炭化水素－カルボニル)－アミノ基」としては、ビス (アルキル－カルボニル)－アミノ基、ビス (アルケニル－カルボニル)－アミノ基、ビス (アルキニル－カルボニル)－アミノ基、ビス (シクロアルキル－カルボニル)－アミノ基、ビス (シクロアルケニル－カルボニル)－アミノ基、ビス (シクロアルカンジエニル－カルボニル)－アミノ基、ビス (シクロアルキル－アルキル－カルボニル)－アミノ基等のビス (脂肪族炭化水素－カルボニル)－アミノ基；ビス (アリール－カルボニル)－アミノ基；ビス (アラルキル－カルボニル)－アミノ基；ビス (架橋環式炭化水素－カルボニル)－アミノ基；ビス (スピロ環式炭化水素－カルボニル)－アミノ基；ビス (テルペン系炭化水素－カルボニル)－アミノ基が挙げられる。以下、式 ($\omega-2E$) ないし ($\omega-21E$) で表される基も同様である。

上記式 ($\omega-1E$) ないし ($\omega-21E$) で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ($\omega-1E$) で表される「ビス (ヘテロ環－カルボニル)－アミノ基」としては、例えば、ビス (単環式ヘテロアリール－カルボニル)－アミノ基、ビス (縮合多環式ヘテロアリール－カルボニル)－アミノ基、ビス (単環式非芳香族ヘテロ環－カルボニル) アミノ基、ビス (縮合多環式非芳香族ヘテロ環－カルボニル)－アミノ基が挙げられる。以下、式 ($\omega-2E$) ないし ($\omega-21E$) で表される基も同様である。

上記式 ($\omega-10E$) ないし ($\omega-16E$) で表される基における「環状アミ

ノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

上記「アシルーアミノ基」及び「ジ（アシル）ーアミノ基」を総称して、「アシル置換アミノ基」と称する。又、上記「Nー炭化水素ーアミノ基」、「N，Nージ（炭化水素）ーアミノ基」、「Nーヘテロ環ーアミノ基」、「Nー炭化水素ーNーヘテロ環ーアミノ基」、「環状アミノ基」、「アシルーアミノ基」、及び「ジ（アシル）ーアミノ基」を総称して、「置換アミノ基」と称する。更に、これら「置換アミノ基」と「アミノ基」を総称して、「置換基を有していてもよいアミノ基」と称する。

以下、上記一般式（I）で表される化合物について具体的に説明する。

Aの定義における「アシル基」としては、上記定義における「アシル基」と同様の基が挙げられる。

Aは水素原子又はアシル基を表す。好適には、水素原子、「炭化水素ーカルボニル基」、及び「炭化水素ースルホニル基」であり、更に好適には、水素原子、アセチル基、及びパラトルエンスルホニル基である。

Xは酸素原子又はNHを表す。

R¹及びR²は、一方が水素原子、他方が式：-X-Aを表す。R¹及びR²の好適な組み合わせは、R¹が式：-X-Aであり、R²が水素原子である場合である。更に好適には、R¹が式：-O-Aであり、R²が水素原子である場合であり、Aが水素原子、アセチル基、及びパラトルエンスルホニル基である場合が特に好ましい。

Yはスルホニル基（-SO₂-）又はカルボニル基（-CO-）を表す。好適にはスルホニル基である。

R⁵の定義における「置換基を有していてもよい環式基」の「環式基」としては、上記定義における「環式基」と同様の基が挙げられる。好適には、芳香環式基及びシクロアルキル基であり、更に好適には、フェニル基、ナフチル基、フリル基、ピリジル基、ベンゾイミダゾリル基、及びシクロヘキシル基であり、最も好適にはフェニル基である。

R⁵の定義における「置換基を有していてもよい環式基」の「置換基」として

は、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。好適には、塩素原子、フッ素原子などのハロゲン原子；ニトロ基；メチル基、*tert*-ブチル基などのアルキル基；トリフルオロメチル基などのハロゲン化アルキル基；ヒドロキシ基；メトキシ基などのアルコキシ基；メチレンジオキシ基などのアルキレンジオキシ基；アミノ基；ジメチルアミノ基などのN, N-ジ（炭化水素）-アミノ基；メタンスルホニル基などの炭化水素-スルホニル基である。

R⁵は置換基を有していてもよい環式基を表す。好適には、フェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、3-ニトロフェニル基、4-ニトロフェニル基、2-メチルフェニル基、4-（*tert*-ブチル）フェニル基、2-（トリフルオロメチル）フェニル基、4-（トリフルオロメチル）フェニル基、3, 4-ジヒドロキシフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、2, 3-ジメトキシフェニル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、3, 4-メチレンジオキシフェニル基、3-アミノフェニル基、4-（ジメチルアミノ）フェニル基、4-メタンスルホニルフェニル基、1-ナフチル基、5-メチルフラン-2-イル基、ピリジン-2-イル基、ベンゾイミダゾール-2-イル基、及びシクロヘキシル基であり、更に好適には、フェニル基、4-（*tert*-ブチル）フェニル基、及び2, 3-ジメトキシフェニル基である。

Zの定義における「置換基を有していてもよいC₁~C₄のアルキレン基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。

Zの定義における「置換基を有していてもよいC₁~C₄のアルキレン基」の「C₁~C₄のアルキレン基」としては、メチレン基、エチレン基、エタン-1, 1-ジイル基、プロパン-1, 3-ジイル基、プロパン-1, 2-ジイル基、プロパン-2, 2-ジイル基、ブタン-1, 4-ジイル基などのC₁~C₄の直鎖状又は分枝鎖状のアルキレン基が挙げられる。

Zは単結合又は置換基を有していてもよいC₁～C₄のアルキレン基を表す。好適には、単結合、メチレン基、エチレン基、及びエタン-1, 1-ジイル基であり、更に好適には、メチレン基である。

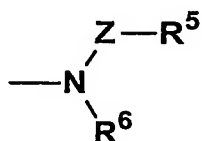
Zが置換基を有する場合、該置換基はR⁵と結合して環式基を形成してもよい。このような具体例として、例えば、式：-Z-R⁵が1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル基である場合などが挙げられる。

R⁶の定義における「置換基を有していてもよいC₁～C₆のアルキル基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。

R⁶の定義における「置換基を有していてもよいC₁～C₆のアルキル基」の「C₁～C₆のアルキル基」としては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、n-ペンチル基、イソペンチル基、n-ヘキシル基などのC₁～C₆の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基が挙げられる。

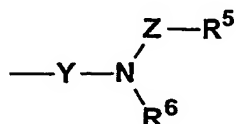
R⁶は水素原子又は置換基を有していてもよいC₁～C₆のアルキル基を表す。好適には、水素原子及びメチル基であり、更に好適には、水素原子である。

R⁶はZ又はR⁵と結合して環式基を形成してもよい。このような具体例として、例えば、下記式：



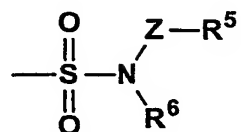
が1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル基、3-フェニルピペリジン-1-イル基などである場合が挙げられる。

R³及びR⁴は、一方が水素原子、他方が下記式：



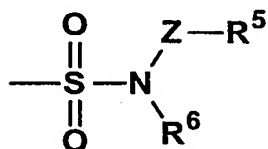
を表す。R³及びR⁴の好適な組み合わせは、

R³が下記式：



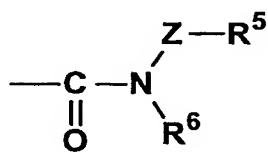
であり、R⁴が水素原子である場合；

R³が水素原子であり、R⁴が下記式：



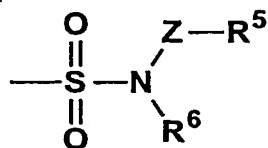
ある場合；及び

R³が下記式：



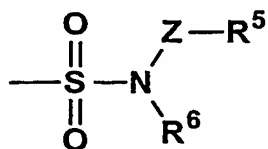
であり、R⁴が水素原子である場合である。更に好適な組み合わせは、

R³が下記式：



であり、R⁴が水素原子である場合；及び

R³が水素原子であり、R⁴が下記式：



ある場合である。

一般式（I）で表される化合物として好適な化合物は、下記に示す化合物であ

る。(化合物番号は、下記化合物表中の番号に対応している。)

- ・ N-ベンジル-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-1);
- ・ N-(2, 6-ジフルオロベンジル)-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-2);
- ・ N-(2, 4-ジクロロベンジル)-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-3);
- ・ N-(3-ニトロベンジル)-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-4);
- ・ N-(4-ニトロベンジル)-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-5);
- ・ N-(2-メチルベンジル)-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-6);
- ・ N-[4-(tert-ブチル) ベンジル]-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-7);
- ・ N-[2-(トリフルオロメチル) ベンジル]-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-8);
- ・ N-[4-(トリフルオロメチル) ベンジル]-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-9);
- ・ N-(3, 4-ジヒドロキシベンジル)-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-10);
- ・ N-(2-メトキシベンジル)-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-11);
- ・ N-(3-メトキシベンジル)-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-12);
- ・ N-(2, 3-ジメトキシベンジル)-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-13);

- ・ N- (3, 5-ジメトキシベンジル) -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-14);
- ・ N- (3, 4-メチレンジオキシベンジル) -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-15);
- ・ N- (3-アミノベンジル) -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-16);
- ・ N- [4- (ジメチルアミノ) ベンジル] -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-17);
- ・ N- [4- (メタンズルホニル) ベンジル] -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-18);
- ・ N- (1-ナフチルメチル) -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-19);
- ・ N- [(5-メチルフラン-2-イル) メチル] -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-20);
- ・ N- [(ピリジン-2-イル) メチル] -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-21);
- ・ N- [(ベンゾイミダゾール-2-イル) メチル] -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-22);
- ・ N-シクロヘキシルメチル-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-23);
- ・ N-フェニル-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-24);
- ・ N- (2-フェネチル) -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-25);
- ・ N- (1-フェネチル) -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-26);

- ・ N-ベンジル-N-メチル-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 1-27);
- ・ N-ベンジル-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-1)
- ・ N-(2, 6-ジフルオロベンジル)-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-2);
- ・ N-(2, 4-ジクロロベンジル)-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-3);
- ・ N-(3-ニトロベンジル)-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-4);
- ・ N-(4-ニトロベンジル)-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-5);
- ・ N-(2-メチルベンジル)-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-6);
- ・ N-[4-(tert-ブチル) ベンジル]-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-7);
- ・ N-[2-(トリフルオロメチル) ベンジル]-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-8);
- ・ N-[4-(トリフルオロメチル) ベンジル]-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-9);
- ・ N-(3, 4-ジヒドロキシベンジル)-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-10);
- ・ N-(2-メトキシベンジル)-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-11);
- ・ N-(3-メトキシベンジル)-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-12);
- ・ N-(2, 3-ジメトキシベンジル)-5-ヒドロキシナフタレン-1-スル

- ホンアミド (化合物番号 2-13);
- ・ N- (3, 5-ジメトキシベンジル) - 5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-14);
 - ・ N- (3, 4-メチレンジオキシベンジル) - 5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-15);
 - ・ N- (3-アミノベンジル) - 5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-16);
 - ・ N- [4- (ジメチルアミノ) ベンジル] - 5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-17);
 - ・ N- [4- (メタンスルホニル) ベンジル] - 5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-18);
 - ・ N- (1-ナフチルメチル) - 5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-19);
 - ・ N- [(5-メチルフラン-2-イル) メチル] - 5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-20);
 - ・ N- [(ピリジン-2-イル) メチル] - 5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-21);
 - ・ N- [(ベンゾイミダゾール-2-イル) メチル] - 5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-22);
 - ・ N-シクロヘキシルメチル-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-23);
 - ・ N-フェニル-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-24);
 - ・ N- (2-フェネチル) - 5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-25);
 - ・ N- (1-フェネチル) - 5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-26);

- ・ N-ベンジル-N-メチル-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 2-27) ;
- ・ 5-アセチルオキシ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 3-1) ;
- ・ 5-アセチルオキシ-N-(2, 4-ジクロロベンジル) ナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 3-2) ;
- ・ 5-アセチルオキシ-N-(3-ニトロベンジル) ナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 3-3) ;
- ・ 5-アセチルオキシ-N-[4-(tert-ブチル) ベンジル] ナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 3-4) ;
- ・ 5-アセチルオキシ-N-[4-(トリフルオロメチル) ベンジル] ナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 3-5) ;
- ・ 5-アセチルオキシ-N-(2, 3-ジメトキシベンジル) ナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 3-6) ;
- ・ 5-アセチルオキシ-N-(3-アミノベンジル) ナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 3-7) ;
- ・ 5-アセチルオキシ-N-(1-ナフチルメチル) ナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 3-8) ;
- ・ 5-アセチルオキシ-N-[(5-メチルフラン-2-イル) メチル] ナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 3-9) ;
- ・ 5-アセチルオキシ-N-[(ピリジン-2-イル) メチル] ナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 3-10) ;
- ・ 5-アセチルオキシ-N-(シクロヘキシルメチル) ナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 3-11) ;
- ・ 5-アセチルオキシ-N-フェニルナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 3-12) ;
- ・ 5-アセチルオキシ-N-(2-フェネチル) ナフタレン-2-スルホンアミド

- ド（化合物番号 3-13）；
- ・ 5-アセチルオキシ-N-（1-フェネチル）ナフタレン-2-スルホンアミド（化合物番号 3-14）；
 - ・ 5-アセチルオキシ-N-ベンジル-N-メチルナフタレン-2-スルホンアミド（化合物番号 3-15）；
 - ・ N-ベンジル-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド（化合物番号 4-1）；
 - ・ N-（2, 4-ジクロロベンジル）-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド（化合物番号 4-2）；
 - ・ N-（3-ニトロベンジル）-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド（化合物番号 4-3）；
 - ・ N-〔4-（tert-ブチル）ベンジル〕-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド（化合物番号 4-4）；
 - ・ N-〔4-（トリフルオロメチル）ベンジル〕-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド（化合物番号 4-5）；
 - ・ N-（2, 3-ジメトキシベンジル）-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド（化合物番号 4-6）；
 - ・ N-（3-アミノベンジル）-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド（化合物番号 4-7）；
 - ・ N-（1-ナフチルメチル）-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド（化合物番号 4-8）；
 - ・ N-〔（5-メチルフラン-2-イル）メチル〕-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド（化合物番号 4-9）；
 - ・ N-〔（ピリジン-2-イル）メチル〕-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド（化合物番号 4-10）；
 - ・ N-（シクロヘキシルメチル）-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド（化合物番号 4-11）；

- ・ N-フェニル-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 4-12) ;
- ・ N-(2-フェネチル)-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 4-13) ;
- ・ N-(1-フェネチル)-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 4-14) ;
- ・ N-ベンジル-N-メチル-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 4-15) ;
- ・ 5-アセチルアミノ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 5-1) ;
- ・ 5-アセチルアミノ-N-[4-(tert-ブチル)ベンジル]ナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 5-2) ;
- ・ 5-アセチルアミノ-N-(2,3-ジメトキシベンジル)ナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 5-3) ;
- ・ 5-アセチルアミノ-N-ベンジル-N-メチルナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 5-4) ;
- ・ 5-アミノ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 6-1 ; 実施例中では塩酸塩である) ;
- ・ 5-アミノ-N-[4-(tert-ブチル)ベンジル]ナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 6-2 ; 実施例中では塩酸塩である) ;
- ・ 5-アミノ-N-(2,3-ジメトキシベンジル)ナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 6-3 ; 実施例中では塩酸塩である) ;
- ・ 5-アミノ-N-ベンジル-N-メチルナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 6-4 ; 実施例中では塩酸塩である) ;
- ・ 6-アセチルアミノ-N-ベンジルナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号 7-1) ;
- ・ 6-アセチルアミノ-N-[4-(tert-ブチル)ベンジル]ナフタレン

- ー 1 ー スルホンアミド (化合物番号 7-2) ;
- ・ 6 ー アセチルアミノ ー N ー (2, 3 ー ジメトキシベンジル) ナフタレン ー 1 ー スルホンアミド (化合物番号 7-3) ;
- ・ 6 ー アミノ ー N ー ベンジルナフタレン ー 1 ー スルホンアミド (化合物番号 8-1 ; 実施例中では塩酸塩である) ;
- ・ 6 ー アミノ ー N ー [4 ー (tert ー ブチル) ベンジル] ナフタレン ー 1 ー スルホンアミド (化合物番号 8-2 ; 実施例中では塩酸塩である) ;
- ・ 6 ー アミノ ー N ー (2, 3 ー ジメトキシベンジル) ナフタレン ー 1 ー スルホンアミド (化合物番号 8-3 ; 実施例中では塩酸塩である) ;
- ・ 6 ー アセチルアミノ ー N ー ベンジルナフタレン ー 2 ー スルホンアミド (化合物番号 9-1) ;
- ・ 6 ー アセチルアミノ ー N ー [4 ー (tert ー ブチル) ベンジル] ナフタレン ー 2 ー スルホンアミド (化合物番号 9-2) ;
- ・ 6 ー アセチルアミノ ー N ー (2, 3 ー ジメトキシベンジル) ナフタレン ー 2 ー スルホンアミド (化合物番号 9-3) ;
- ・ 6 ー アミノ ー N ー ベンジルナフタレン ー 2 ー スルホンアミド (化合物番号 10-1 ; 実施例中では塩酸塩である) ;
- ・ 6 ー アミノ ー N ー [4 ー (tert ー ブチル) ベンジル] ナフタレン ー 2 ー スルホンアミド (化合物番号 10-2 ; 実施例中では塩酸塩である) ;
- ・ 6 ー アミノ ー N ー (2, 3 ー ジメトキシベンジル) ナフタレン ー 2 ー スルホンアミド (化合物番号 10-3 ; 実施例中では塩酸塩である) ;
- ・ 5 ー アミノ ー N ー ベンジルナフタレン ー 1 ー カルボキサミド (化合物番号 11-1) ;
- ・ 5 ー アミノ ー N ー [4 ー (tert ー ブチル) ベンジル] ナフタレン ー 1 ー カルボキサミド (化合物番号 11-2) ;
- ・ 5 ー アミノ ー N ー (2, 3 ー ジメトキシベンジル) ナフタレン ー 1 ー カルボキサミド (化合物番号 11-3) 。

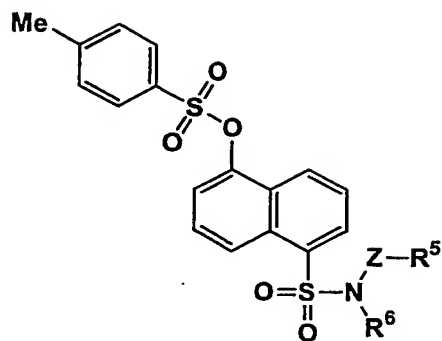
一般式（I）で表される化合物は、塩を形成することができる。塩の種類は特に限定されないが、酸性基が存在する場合には、例えば、リチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩、マグネシウム塩、カルシウム塩等の金属塩；又はアンモニウム塩、メチルアンモニウム塩、ジメチルアンモニウム塩、トリメチルアンモニウム塩、ジシクロヘキシルアンモニウム塩等のアンモニウム塩を挙げることができる。塩基性基が存在する場合には、例えば、塩酸塩、臭化水素酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩等の鉱酸塩、あるいはメタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、酢酸塩、プロピオン酸塩、酒石酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、リンゴ酸塩、シュウ酸塩、コハク酸塩、クエン酸塩、安息香酸塩、マンデル酸塩、ケイ皮酸塩、乳酸塩等の有機酸塩を挙げることができる。グリシンなどのアミノ酸との塩を形成する場合もある。本発明の医薬の有効成分としては、薬理学的に許容される塩が好適である。

一般式（I）で表される化合物又はその塩は、水和物又は溶媒和物として存在する場合もある。更に一般式（I）で表される化合物は1以上の不斉炭素を有する場合があります、光学活性体やジアステレオマーなどの立体異性体として存在する場合がある。本発明の医薬の有効成分としては、純粋な形態の立体異性体、光学対掌体又はジアステレオマーの任意の混合物、ラセミ体などを用いてもよい。又、一般式（I）で表される化合物がオレフィン性の二重結合を有する場合には、その配置はZ配置又はE配置のいずれでもよく、本発明の医薬の有効成分としてはいずれかの配置の幾何異性体又はそれらの混合物を用いてもよい。

本発明の医薬の有効成分として一般式（I）に包含される化合物を以下に例示するが、本発明の医薬の有効成分は下記の化合物に限定されることはない。

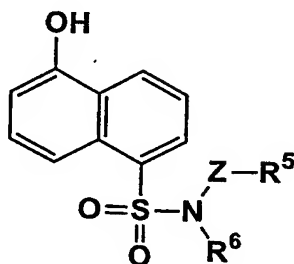
なお、下記表において用いられる略語の意味は下記の通りである。

Me：メチル基。



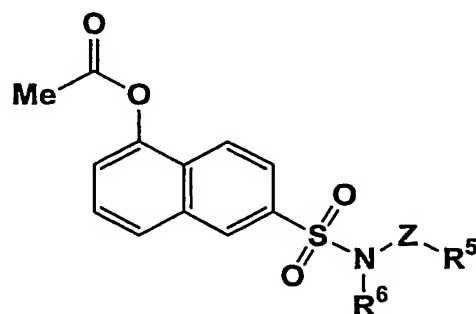
化合物番号	Z	R ⁵	R ⁶
1-1	-CH ₂ -	フェニル	H
1-2	-CH ₂ -	2, 6-ジ ^o フルオロフェニル	H
1-3	-CH ₂ -	2, 4-ジ ^o クロロフェニル	H
1-4	-CH ₂ -	3-ニトロフェニル	H
1-5	-CH ₂ -	4-ニトロフェニル	H
1-6	-CH ₂ -	2-メチルフェニル	H
1-7	-CH ₂ -	4-(tert-ブチル)フェニル	H
1-8	-CH ₂ -	2-(トリフルオロメチル)フェニル	H
1-9	-CH ₂ -	4-(トリフルオロメチル)フェニル	H
1-10	-CH ₂ -	3, 4-ジ ^o ヒト ^o ロキシフェニル	H
1-11	-CH ₂ -	2-メトシフェニル	H
1-12	-CH ₂ -	3-メトシフェニル	H
1-13	-CH ₂ -	2, 3-ジ ^o メトシフェニル	H
1-14	-CH ₂ -	3, 5-ジ ^o メトシフェニル	H
1-15	-CH ₂ -	3, 4-メチレンジ ^o オキシフェニル	H
1-16	-CH ₂ -	3-アミノフェニル	H
1-17	-CH ₂ -	4-(ジ ^o メチルアミノ)フェニル	H
1-18	-CH ₂ -	4-メタンホルモニルフェニル	H
1-19	-CH ₂ -	1-ナフチル	H
1-20	-CH ₂ -	5-メチルフランソ-2-イル	H
1-21	-CH ₂ -	ピ ^o リジ ^o ソ-2-イル	H
1-22	-CH ₂ -	ベンゾ ^o イミダ ^o ゾール-2-イル	H
1-23	-CH ₂ -	シクロヘキシル	H
1-24	単結合	フェニル	H
1-25	-CH ₂ CH ₂ -	フェニル	H

1-26	$-\text{CH}(\text{CH}_3)-$	フェニル	H
1-27	$-\text{CH}_2-$	フェニル	Me

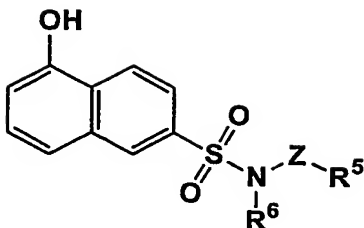


化合物番号	Z	R ⁵	R ⁶
2-1	$-\text{CH}_2-$	フェニル	H
2-2	$-\text{CH}_2-$	2, 6-ジフルオロフェニル	H
2-3	$-\text{CH}_2-$	2, 4-ジクロロフェニル	H
2-4	$-\text{CH}_2-$	3-ニトロフェニル	H
2-5	$-\text{CH}_2-$	4-ニトロフェニル	H
2-6	$-\text{CH}_2-$	2-メチルフェニル	H
2-7	$-\text{CH}_2-$	4-(tert-ブチル)フェニル	H
2-8	$-\text{CH}_2-$	2-(トリフルオロメチル)フェニル	H
2-9	$-\text{CH}_2-$	4-(トリフルオロメチル)フェニル	H
2-10	$-\text{CH}_2-$	3, 4-ジヒドロキシフェニル	H
2-11	$-\text{CH}_2-$	2-メトキシフェニル	H
2-12	$-\text{CH}_2-$	3-メトキシフェニル	H
2-13	$-\text{CH}_2-$	2, 3-ジメトキシフェニル	H
2-14	$-\text{CH}_2-$	3, 5-ジメトキシフェニル	H
2-15	$-\text{CH}_2-$	3, 4-メチレンジオキシフェニル	H
2-16	$-\text{CH}_2-$	3-アミノフェニル	H
2-17	$-\text{CH}_2-$	4-(ジメチルアミノ)フェニル	H
2-18	$-\text{CH}_2-$	4-メタンサルホンフェニル	H
2-19	$-\text{CH}_2-$	1-ナフチル	H
2-20	$-\text{CH}_2-$	5-メチルフランソ-2-イル	H
2-21	$-\text{CH}_2-$	ヒリジソ-2-イル	H
2-22	$-\text{CH}_2-$	ベンゾイミダゾール-2-イル	H
2-23	$-\text{CH}_2-$	シクロヘキシル	H

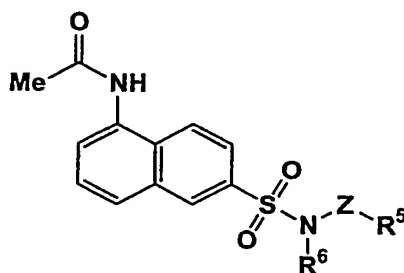
2-24	単結合	フェニル	H
2-25	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	フェニル	H
2-26	$-\text{CH}(\text{CH}_3)-$	フェニル	H
2-27	$-\text{CH}_2-$	フェニル	Me



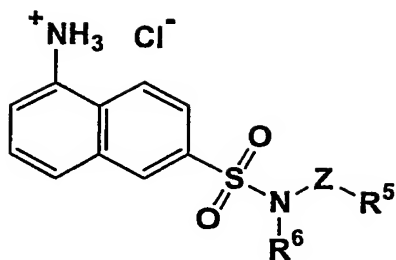
化合物番号	Z	R ⁵	R ⁶
3-1	$-\text{CH}_2-$	フェニル	H
3-2	$-\text{CH}_2-$	2, 4-ジクロロフェニル	H
3-3	$-\text{CH}_2-$	3-ニトロフェニル	H
3-4	$-\text{CH}_2-$	4-(tert-ブチル)フェニル	H
3-5	$-\text{CH}_2-$	4-(トリフルオロメチル)フェニル	H
3-6	$-\text{CH}_2-$	2, 3-ジメトキシフェニル	H
3-7	$-\text{CH}_2-$	3-アミノフェニル	H
3-8	$-\text{CH}_2-$	1-ナフチル	H
3-9	$-\text{CH}_2-$	5-メチルフランソ-2-イル	H
3-10	$-\text{CH}_2-$	ピリジソ-2-イル	H
3-11	$-\text{CH}_2-$	シクロヘキシル	H
3-12	単結合	フェニル	H
3-13	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	フェニル	H
3-14	$-\text{CH}(\text{CH}_3)-$	フェニル	H
3-15	$-\text{CH}_2-$	フェニル	Me



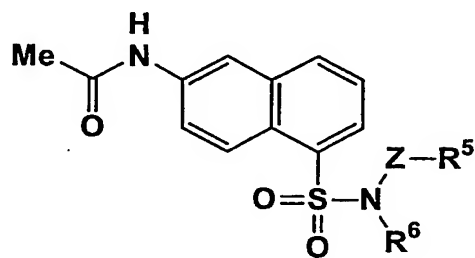
化合物番号	Z	R ⁵	R ⁶
4-1	-CH ₂ -	フェニル	H
4-2	-CH ₂ -	2, 4-ジクロロフェニル	H
4-3	-CH ₂ -	3-ニトロフェニル	H
4-4	-CH ₂ -	4-(tert-ブチル)フェニル	H
4-5	-CH ₂ -	4-(トリフルオロメチル)フェニル	H
4-6	-CH ₂ -	2, 3-ジメトシキフェニル	H
4-7	-CH ₂ -	3-アミノフェニル	H
4-8	-CH ₂ -	1-ナフチル	H
4-9	-CH ₂ -	5-メチルフランソ-2-イル	H
4-10	-CH ₂ -	ピリジンソ-2-イル	H
4-11	-CH ₂ -	シクロヘキシル	H
4-12	単結合	フェニル	H
4-13	-CH ₂ CH ₂ -	フェニル	H
4-14	-CH(CH ₃)-	フェニル	H
4-15	-CH ₂ -	フェニル	Me



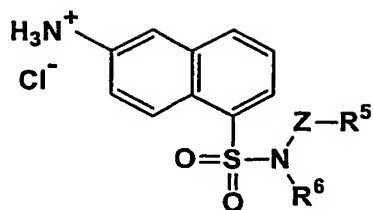
化合物番号	Z	R ⁵	R ⁶
5-1	-CH ₂ -	フェニル	H
5-2	-CH ₂ -	4-(tert-ブチル)フェニル	H
5-3	-CH ₂ -	2, 3-ジメトシキフェニル	H
5-4	-CH ₂ -	フェニル	Me



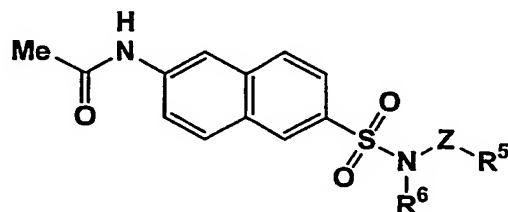
化合物番号	Z	R ⁵	R ⁶
6-1	-CH ₂ -	フェニル	H
6-2	-CH ₂ -	4-(tert-ブチル)フェニル	H
6-3	-CH ₂ -	2,3-ジメトキシフェニル	H
6-4	-CH ₂ -	フェニル	Me



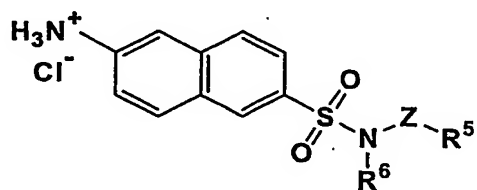
化合物番号	Z	R ⁵	R ⁶
7-1	-CH ₂ -	フェニル	H
7-2	-CH ₂ -	4-(tert-ブチル)フェニル	H
7-3	-CH ₂ -	2,3-ジメトキシフェニル	H



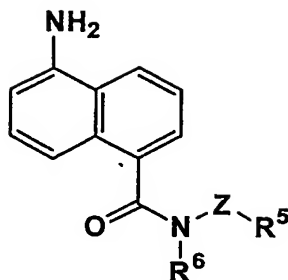
化合物番号	Z	R ⁵	R ⁶
8-1	-CH ₂ -	フェニル	H
8-2	-CH ₂ -	4-(tert-ブチル)フェニル	H
8-3	-CH ₂ -	2,3-ジメトキシフェニル	H



化合物番号	Z	R ⁵	R ⁶
9-1	-CH ₂ -	フェニル	H
9-2	-CH ₂ -	4-(tert-ブチル)フェニル	H
9-3	-CH ₂ -	2,3-ジメトキシフェニル	H



化合物番号	Z	R ⁵	R ⁶
10-1	-CH ₂ -	フェニル	H
10-2	-CH ₂ -	4-(tert-ブチル)フェニル	H
10-3	-CH ₂ -	2,3-ジメトキシフェニル	H

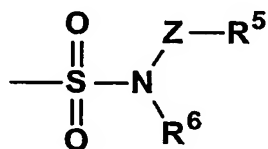


化合物番号	Z	R ⁵	R ⁶
11-1	-CH ₂ -	フェニル	H
11-2	-CH ₂ -	4-(tert-ブチル)フェニル	H
11-3	-CH ₂ -	2,3-ジメトキシフェニル	H

本発明の一般式 (I) で表される化合物は、例えば、下記に示すような方法で製造することができる。

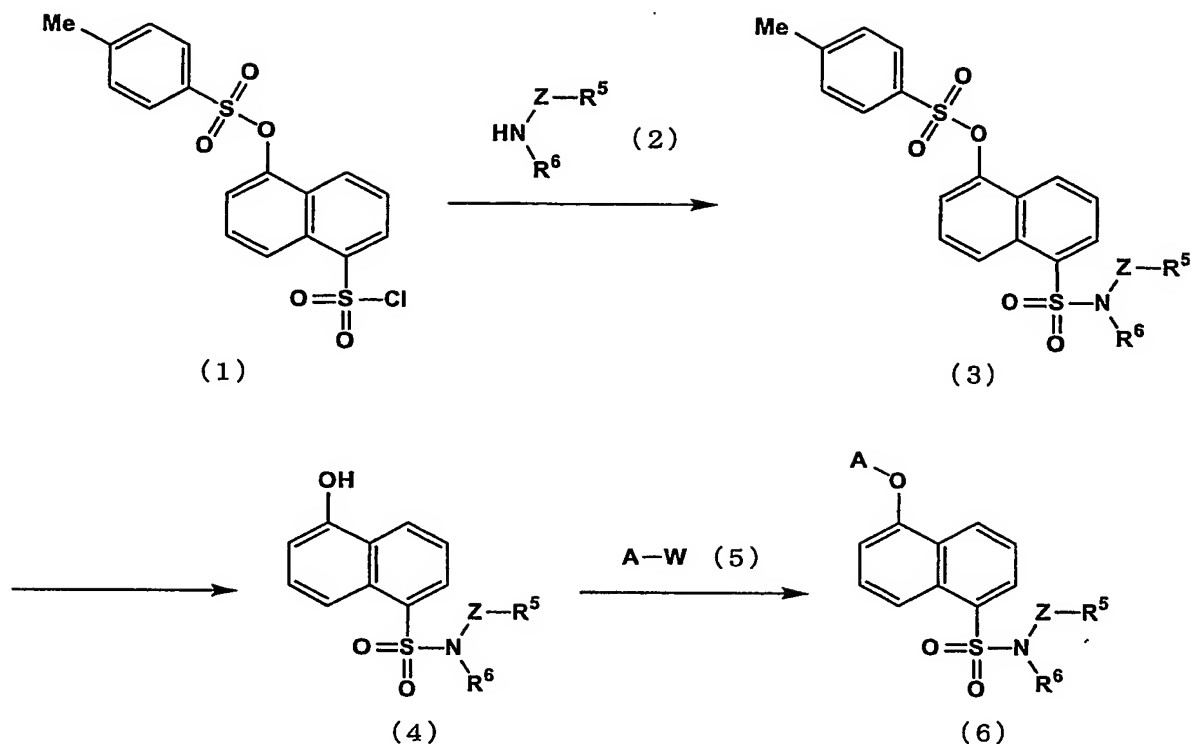
《製造法 1》

本発明の一般式 (I) で表される化合物において、R¹が式：-O-A (式中、Aは水素原子又はアシル基を表す。) で表される基であり、R²が水素原子であり、R³が下記式：



(式中、R⁵は置換基を有していてもよい環式基を示し、Zは単結合又は置換基を有していてもよいC₁~C₄のアルキレン基を示し、ここで、該Zが置換基を有する場合、該置換基はR⁵と結合して環式基を形成してもよく、R⁶は水素原子又は置換基を有していてもよいC₁~C₆のアルキル基を示し、ここで、R⁶はZ又はR⁵と結合して環式基を形成してもよい) で表される基であり、R⁴が水素原子である化合物は、例えば、反応工程式 1 に示す方法によって製造することができる。

<反応工程式 1>



5-[[4-メチルフェニル]スルホニル]オキシ}ナフタレン-1-スルホニルクロリド(1)は、例えば、米国特許第5378715号に開示された製造法によって製造できる。アミン(2)(R⁵、R⁶及びZは一般式(I)における定義と同義である。)は、その多くが遊離又は酸付加塩として広く市販されており、これ入手して直接使用することが可能である。又、アミン(2)(R⁵、R⁶及びZは一般式(I)における定義と同義である。)は、当業者に容易に理解される製造法(例えば、対応するニトロ体の還元、シアノ体の還元、カルバモイル体の還元など)によっても製造可能であり、本発明の化合物の製造に使用可能であることは言うまでもない。

まず、5-[[4-メチルフェニル]スルホニル]オキシ}ナフタレン-1-スルホニルクロリド(1)とアミン(2)(R⁵、R⁶及びZは一般式(I)における定義と同義である。)を反応させることにより、式(3)の化合物(R⁵、R⁶及びZは一般式(I)における定義と同義である。)を製造することができる。なお、式(3)で表される化合物は、一般式(I)に包含される化合物である。

この反応は、塩基及び／又は触媒の存在又は非存在下、無溶媒又は溶媒中、 -30°C ないし溶媒の加熱還流温度（無溶媒の場合は -30°C ないし 150°C ）の反応温度で行われる。

塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基；ピリジン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N, N-ジエチルアニリン等の有機塩基が挙げられる。触媒としては、例えば、4-ジメチルアミノピリジン、テトラブチルアンモニウムブロミド等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、蟻酸エチル、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン類；テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類；ベンゼン、トルエン、モノクロロベンゼン、1, 2-ジクロロベンゼン等の置換又は非置換ベンゼン類；N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類；メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水等を挙げることができ、これらの溶媒を単独、混合あるいは2相系の溶媒として用いることができる。

次に、得られた式(3)の化合物(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)のトシル基を加水分解することにより、式(4)で表される化合物(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)を製造することができる。なお、式(4)で表される化合物は、一般式(I)に包含される化合物である。この反応は、酸あるいは塩基の存在下、無溶媒又は溶媒中 0°C から溶媒の加熱還流温度（無溶媒の場合は 0°C ないし 150°C ）の反応温度で行われる。

酸としては、例えば、塩酸、硫酸等の鉱酸；蟻酸、酢酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸；塩化アルミニウム、テトラフルオロホウ酸トリエチルオキシニウム等のルイス酸が挙げられる。塩基としては、例えば、水

酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基；ヒドラジン等の有機塩基等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類；メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール等のアルコール類；水等を挙げることができ、これらの溶媒を単独あるいは混合溶媒として用いることができる。

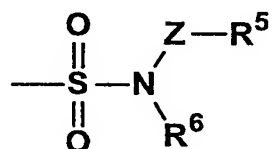
次に、得られた式(4)の化合物(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)とアシル化剤(5)(Aはアシル基を表し、Wはハロゲン原子；アセトキシ基、ベンゾイルオキシ基、メタンスルホニルオキシ基、トシル基等のアシルオキシ基；(2, 5-ジオキソピロリジン-1-イル)オキシ基等のイミドオキシ基；1-イミダゾリル基；ヒドロキシ基等を表す。)を反応させることにより、一般式(I)に包含される化合物である式(6)の化合物(A、 R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)を製造することができる。この反応は、塩基及び／又はアシル化補助剤の存在又は非存在下、無溶媒又は溶媒中、 -30°C ないし溶媒の加熱還流温度(無溶媒の場合は -30°C ないし 150°C)の反応温度で行われる。

塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基；ピリジン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N, N-ジエチルアニリン等の有機塩基が挙げられる。アシル化補助剤としては、例えば、4-ジメチルアミノピリジン、テトラブチルアンモニウムブロミド等の触媒；塩化チオニル、オキシ塩化リン、三塩化リン、クロロ蟻酸エチル、4-ニトロベンゼンスルホニルクロリド等のハロゲン化合物；N, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]-3-エチルカルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、蟻酸エチル、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン類；テトラヒドロフラン、1,

2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類；ベンゼン、トルエン、モノクロロベンゼン、1, 2-ジクロロベンゼン等の置換又は非置換ベンゼン類；N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類；メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水等を挙げることができ、これらの溶媒を単独、混合あるいは2相系の溶媒として用いることができる。

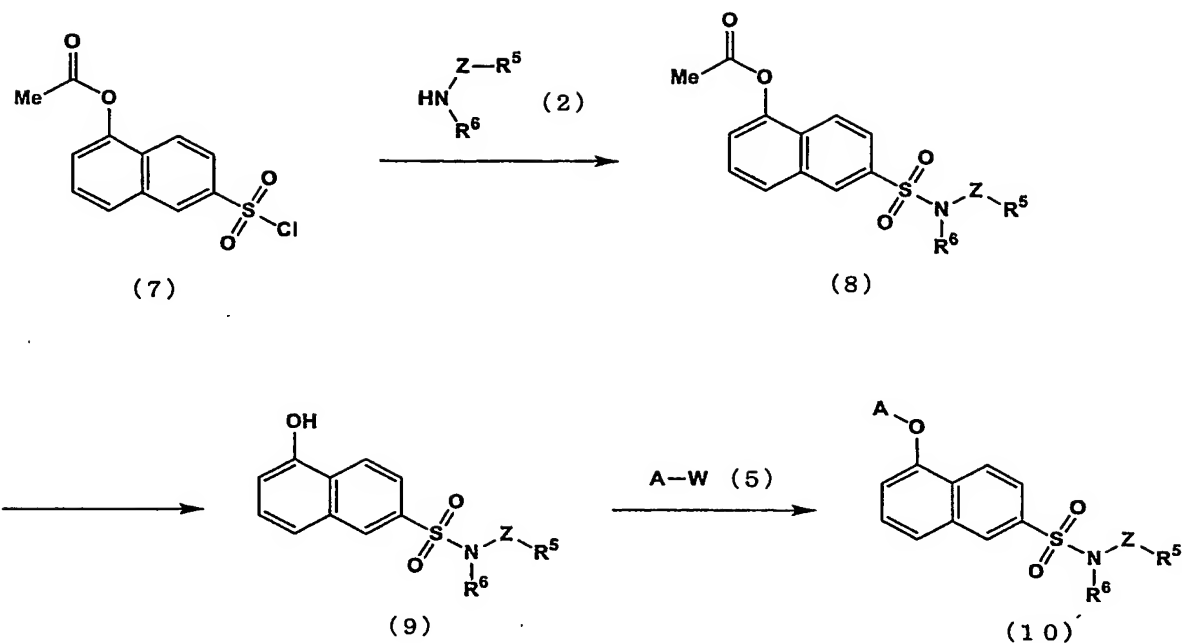
《製造法2》

本発明の一般式(I)で表される化合物において、 R^1 が式： $-O-A$ （式中、 A は水素原子又はアシル基を表す。）で表される基であり、 R^2 が水素原子であり、 R^3 が水素原子であり、 R^4 が下記式：



（式中、 R^5 は置換基を有していてもよい環式基を示し、 Z は単結合又は置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_4$ のアルキレン基を示し、ここで、該 Z が置換基を有する場合には、該置換基は R^5 と結合して環式基を形成してもよく、 R^6 は水素原子又は置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基を示し、ここで、 R^6 は Z 又は R^5 と結合して環式基を形成してもよい。）で表される基である化合物は、例えば、反応工程式2に示す方法によって製造することができる。

<反応工程式2>



5-(アセチルオキシ)ナフタレン-2-ルスルホニルクロリド (7) は、例えば、テトラヘドロン (Tetrahedron)、第48巻、第42号、9207-9216ページ (1992年発行)、及び日本国特公昭60-140240号公報に開示された製造法に従って製造できる。アミン (2) (R^5 、 R^6 及びZは一般式 (I) における定義と同義である。) は、《製造法1》において示した方法で入手可能である。

まず、5-(アセチルオキシ)ナフタレン-2-ルスルホニルクロリド (7) とアミン (2) (R^5 、 R^6 及びZは一般式 (I) における定義と同義である。) を反応させることにより、式 (8) の化合物 (R^5 、 R^6 及びZは一般式 (I) における定義と同義である。) を製造することができる。なお、式 (8) で表される化合物は、一般式 (I) に包含される化合物である。この反応は、塩基及び／又は触媒の存在又は非存在下、無溶媒又は溶媒中、 -30°C ないし溶媒の加熱還流温度 (無溶媒の場合は -30°C ないし 150°C) の反応温度で行われる。

塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基；ピリジン、トリエチルアミン、

ジイソプロピルエチルアミン、N, N-ジエチルアニリン等の有機塩基が挙げられる。触媒としては、例えば、4-ジメチルアミノピリジン、テトラブチルアンモニウムブロミド等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、蟻酸エチル、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン類；テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類；ベンゼン、トルエン、モノクロロベンゼン、1, 2-ジクロロベンゼン等の置換又は非置換ベンゼン類；N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類；メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水等を挙げることができ、これらの溶媒を単独、混合あるいは2相系の溶媒として用いることができる。

次に、得られた式(8)の化合物(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)のアセチル基を加水分解することにより、式(9)で表される化合物(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)を製造することができる。なお、式(9)で表される化合物は、一般式(I)に包含される化合物である。この反応は、酸あるいは塩基の存在下、無溶媒又は溶媒中0℃から溶媒の加熱還流温度(無溶媒の場合は0℃ないし150℃)の反応温度で行われる。

酸としては、例えば、塩酸、硫酸等の鉱酸；蟻酸、酢酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸；塩化アルミニウム、テトラフルオロホウ酸トリエチルオキソニウム等のルイス酸が挙げられる。塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基；ヒドラジン等の有機塩基等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類；メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール等のアルコール類；水等を挙げることができ、

これらの溶媒を単独あるいは混合溶媒として用いることができる。

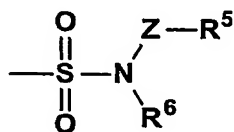
次に、得られた式(9)の化合物(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)とアシル化剤(5)(Aはアシル基を表し、Wはハロゲン原子；アセトキシ基、ベンゾイルオキシ基、メタンスルホニルオキシ基、トシル基等のアシルオキシ基；(2, 5-ジオキソピロリジン-1-イル)オキシ基等のイミドオキシ基；1-イミダゾリル基；ヒドロキシ基等を表す。)を反応させることにより、一般式(I)に包含される化合物である、式(10)の化合物(A、 R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)を製造することができる。この反応は、塩基及び／又はアシル化補助剤の存在又は非存在下、無溶媒又は溶媒中、 -30°C ないし溶媒の加熱還流温度(無溶媒の場合は -30°C ないし 150°C)の反応温度で行われる。

塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基；ピリジン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N, N-ジエチルアニリン等の有機塩基が挙げられる。アシル化補助剤としては、例えば、4-ジメチルアミノピリジン、テトラブチルアンモニウムブロミド等の触媒；塩化チオニル、オキシ塩化リン、三塩化リン、クロロ蟻酸エチル、4-ニトロベンゼンスルホニルクロリド等のハロゲン化物；N, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]-3-エチルカルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、蟻酸エチル、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン類；テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類；ベンゼン、トルエン、モノクロロベンゼン、1, 2-ジクロロベンゼン等の置換又は非置換ベンゼン類；N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類；メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水等を挙げることができ、これら

の溶媒を単独、混合あるいは2相系の溶媒として用いることができる。

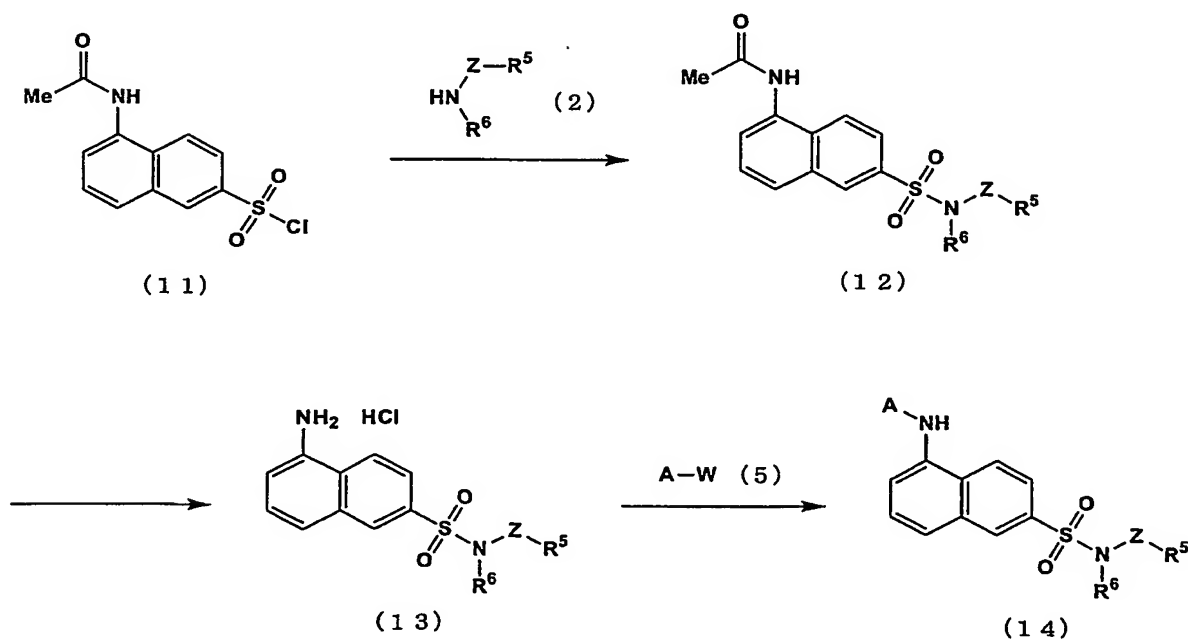
《製造法3》

本発明の一般式(I)で表される化合物において、 R^1 が式： $-NH-A$ （式中、 A は水素原子又はアシル基を表す。）で表される基であり、 R^2 が水素原子であり、 R^3 が水素原子であり、 R^4 が下記式：



（式中、 R^5 は置換基を有していてもよい環式基を示し、 Z は単結合又は置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_4$ のアルキレン基を示し、ここで、該 Z が置換基を有する場合、該置換基は R^5 と結合して環式基を形成してもよく、 R^6 は水素原子又は置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基を示し、ここで、 R^6 は Z 又は R^5 と結合して環式基を形成してもよい。）で表される基である化合物は、例えば、反応工程式3に示す方法によって製造することができる。

<反応工程式3>



5-(アセチルアミノ)ナフタレン-2-スルホニルクロリド(11)は、例えば、米国特許第5378715号明細書に開示された製造法によって製造できる。アミン(2)(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)は、《製造法1》において示した方法で入手可能である。

まず、5-(アセチルアミノ)ナフタレン-2-スルホニルクロリド(11)とアミン(2)(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)を反応させることにより、式(12)の化合物(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)を製造することができる。なお、式(12)で表される化合物は、一般式(I)に包含される化合物である。この反応は、塩基及び/又は触媒の存在又は非存在下、無溶媒又は溶媒中、 -30°C ないし溶媒の加熱還流温度(無溶媒の場合は -30°C ないし 150°C)の反応温度で行われる。

塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基；ピリジン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N,N-ジエチルアニリン等の有機塩基が挙げられる。触媒としては、例えば、4-ジメチルアミノピリジン、テトラブチルアンモニウムブロミド等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、蟻酸エチル、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン類；テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、1,4-ジオキサン等のエーテル類；ベンゼン、トルエン、モノクロロベンゼン、1,2-ジクロロベンゼン等の置換又は非置換ベンゼン類；N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類；メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水等を挙げることができ、これらの溶媒を単独、混合あるいは2相系の溶媒として用いることができる。

次に、得られた式(12)の化合物(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)のアセチル基を加水分解することにより、式(13)で表さ

れる化合物 (R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)を製造することができる。なお、式(13)で表される化合物は、一般式(I)に包含される化合物である。この反応は、酸あるいは塩基の存在下、無溶媒又は溶媒中0℃から溶媒の加熱還流温度(無溶媒の場合は0℃ないし150℃)の反応温度で行われる。

酸としては、例えば、塩酸、硫酸等の鉱酸；テトラフルオロホウ酸トリエチルオキソニウム等のルイス酸が挙げられる。塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、金属ナトリウム等の無機塩基；ヒドラジン等の有機塩基等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、1,4-ジオキサン等のエーテル類；メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール等のアルコール類；水等を挙げることができ、これらの溶媒を単独あるいは混合溶媒として用いることができる。

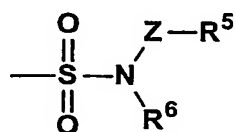
次に、得られた式(13)の化合物(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)とアシル化剤(5)(Aはアシル基を示し、Wはハロゲン原子；アセトキシ基、ベンゾイルオキシ基、メタンスルホニルオキシ基、トシル基等のアシルオキシ基；(2,5-ジオキソピロリジン-1-イル)オキシ基等のイミドオキシ基；1-イミダゾリル基；ヒドロキシ基等を示す。)を反応させることにより、一般式(I)に包含される化合物である式(14)の化合物(A、 R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)を製造することができる。この反応は、塩基及び／又はアシル化補助剤の存在又は非存在下、無溶媒又は溶媒中、-30℃ないし溶媒の加熱還流温度(無溶媒の場合は-30℃ないし150℃)の反応温度で行われる。

塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基；ピリジン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N,N-ジエチルアニリン等の有機塩基が挙げられる。アシル化補助剤としては、例えば、4-ジメチルアミノピリジン、テトラ

ブチルアンモニウムブロミド等の触媒；塩化チオニル、オキシ塩化リン、三塩化リン、クロロ蟻酸エチル、4-ニトロベンゼンスルホニルクロリド等のハロゲン化物；N, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]-3-エチルカルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、蟻酸エチル、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン類；テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類；ベンゼン、トルエン、モノクロロベンゼン、1, 2-ジクロロベンゼン等の置換又は非置換ベンゼン類；N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類；メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水等を挙げることができ、これらの溶媒を単独、混合あるいは2相系の溶媒として用いることができる。

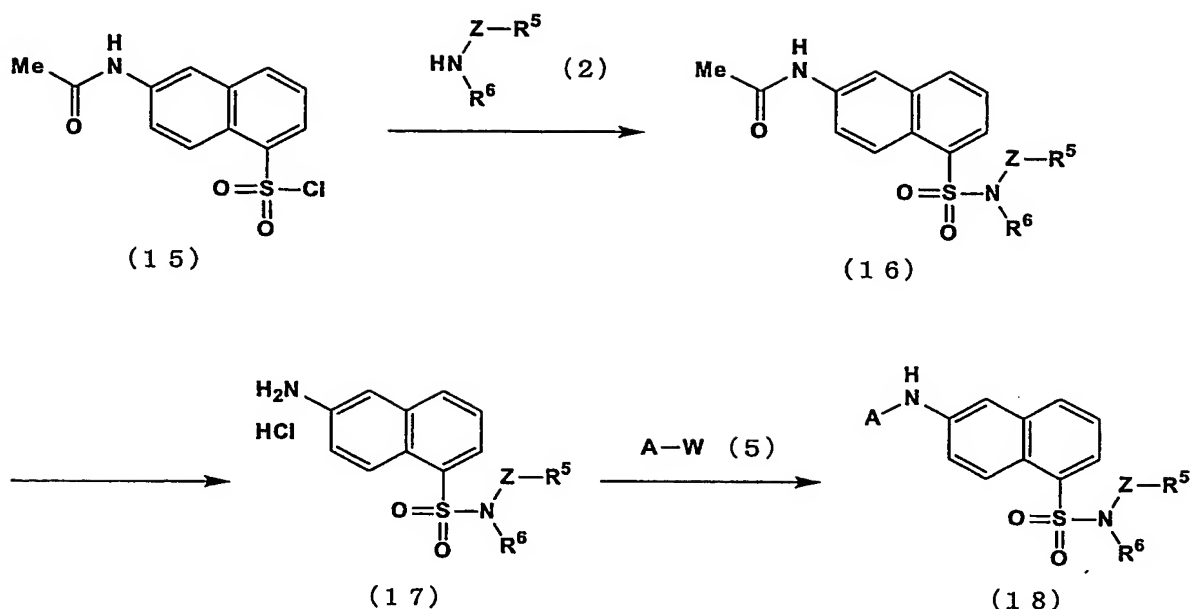
《製造法 4》

本発明の一般式 (I) で表される化合物において、 R^1 が水素原子であり、 R^2 が式： $-NH-A$ （式中、Aは水素原子又はアシル基を示す。）で表される基であり、 R^3 が下記式：



（式中、 R^5 は置換基を有していてもよい環式基を示し、Zは単結合又は置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_4$ のアルキレン基を示し、ここで、該Zが置換基を有する場合、該置換基は R^5 と結合して環式基を形成してもよく、 R^6 は水素原子又は置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基を示し、ここで、 R^6 はZ又は R^5 と結合して環式基を形成してもよい。）で表される基であり、 R^4 が水素原子である化合物は、例えば、反応工程式4に示す方法によって製造することができる。

<反応工程式 4>



6-（アセチルアミノ）ナフタレン-1-スルホニルクロリド（15）は、例えば、米国特許第5378715号明細書に開示された製造法によって製造できる。アミン（2）（R⁵、R⁶及びZは一般式（I）における定義と同義である。）は、《製造法1》において示した方法で入手可能である。

まず、6-（アセチルアミノ）ナフタレン-1-スルホニルクロリド（15）とアミン（2）（R⁵、R⁶及びZは一般式（I）における定義と同義である。）を反応させることにより、式（16）の化合物（R⁵、R⁶及びZは一般式（I）における定義と同義である。）を製造することができる。なお、式（16）で表される化合物は、一般式（I）に包含される化合物である。この反応は、塩基及び／又は触媒の存在又は非存在下、無溶媒又は溶媒中、-30℃ないし溶媒の加熱還流温度（無溶媒の場合は-30℃ないし150℃）の反応温度で行われる。

塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基；ピリジン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N，N-ジエチルアニリン等の有機塩基が挙げられる。触媒としては、例えば、4-ジメチルアミノピリジン、テトラブチルアン

モニウムブロミド等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、蟻酸エチル、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン類；テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類；ベンゼン、トルエン、モノクロロベンゼン、1, 2-ジクロロベンゼン等の置換又は非置換ベンゼン類；N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類；メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水等を挙げることができ、これらの溶媒を単独、混合あるいは2相系の溶媒として用いることができる。

次に、得られた式(16)の化合物(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)のアセチル基を加水分解することにより、式(17)で表される化合物(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)を製造することができる。なお、式(17)で表される化合物は、一般式(I)に包含される化合物である。この反応は、酸あるいは塩基の存在下、無溶媒又は溶媒中0℃から溶媒の加熱還流温度(無溶媒の場合は0℃ないし150℃)の反応温度で行われる。

酸としては、例えば、塩酸、硫酸等の鉱酸；テトラフルオロホウ酸トリエチルオキソニウム等のルイス酸が挙げられる。塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、金属ナトリウム等の無機塩基；ヒドラジン等の有機塩基等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類；メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール等のアルコール類；水等を挙げることができ、これらの溶媒を単独あるいは混合溶媒として用いることができる。

次に、得られた式(17)の化合物(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)とアシル化剤(5)(Aはアシル基を示し、Wはハロゲン原

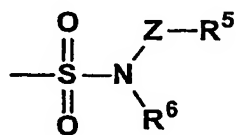
子；アセトキシ基、ベンゾイルオキシ基、メタンスルホニルオキシ基、トシル基等のアシルオキシ基；(2, 5-ジオキソピロリジン-1-イル) オキシ基等のイミドオキシ基；1-イミダゾリル基；ヒドロキシ基等を示す。) を反応させることにより、一般式 (I) に包含される化合物である式 (18) の化合物 (A、R⁵、R⁶及びZは一般式 (I) における定義と同義である。) を製造することができる。この反応は、塩基及び／又はアシル化補助剤の存在又は非存在下、無溶媒又は溶媒中、-30℃ないし溶媒の加熱還流温度（無溶媒の場合は-30℃ないし150℃）の反応温度で行われる。

塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基；ピリジン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N, N-ジエチルアニリン等の有機塩基が挙げられる。アシル化補助剤としては、例えば、4-ジメチルアミノピリジン、テトラブチルアンモニウムブロミド等の触媒；塩化チオニル、オキシ塩化リン、三塩化リン、クロロ蟻酸エチル、4-ニトロベンゼンスルホニルクロリド等のハロゲン化物；N, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]-3-エチルカルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、蟻酸エチル、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン類；テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類；ベンゼン、トルエン、モノクロロベンゼン、1, 2-ジクロロベンゼン等の置換又は非置換ベンゼン類；N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類；メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水等を挙げることができ、これらの溶媒を単独、混合あるいは2相系の溶媒として用いることができる。

《製造法5》

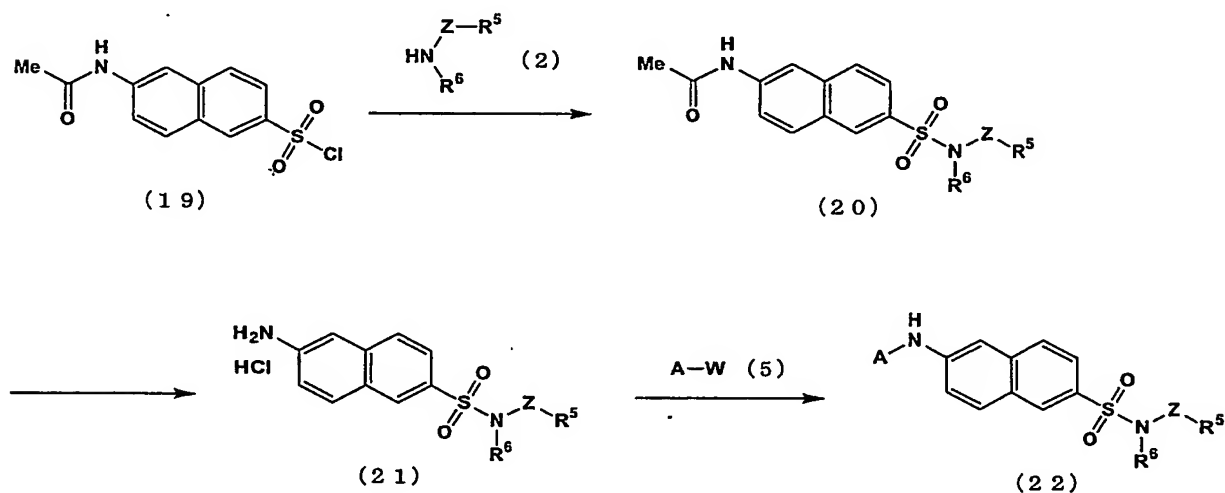
本発明の一般式 (I) で表される化合物において、R¹が水素原子であり、R²

が式：—NH—A（式中、Aは水素原子又はアシル基を示す。）で表される基であり、 R^3 が水素原子であり、 R^4 が下記式：



（式中、 R^5 は置換基を有していてもよい環式基を示し、Zは単結合又は置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_4$ のアルキレン基を示し、ここで、該Zが置換基を有する場合、該置換基は R^5 と結合して環式基を形成してもよく、 R^6 は水素原子又は置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基を示し、ここで、 R^6 はZ又は R^5 と結合して環式基を形成してもよい。）で表される基である化合物は、例えば、反応工程式5に示す方法によって製造することができる。

<反応工程式5>



6-(アセチルアミノ)ナフタレン-2-スルホニルクロリド(19)は、例えば、米国特許第5378715号明細書に開示された製造法によって製造できる。アミン(2)(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)は、《製造法1》において示した方法で入手可能である。

まず、6-(アセチルアミノ)ナフタレン-2-スルホニルクロリド(19)

とアミン (2) (R^5 、 R^6 及びZは一般式 (I) における定義と同義である。) を反応させることにより、式 (20) の化合物 (R^5 、 R^6 及びZは一般式 (I) における定義と同義である。) を製造することができる。なお、式 (20) で表される化合物は、一般式 (I) に包含される化合物である。この反応は、塩基及び/又は触媒の存在又は非存在下、無溶媒又は溶媒中、 -30°C ないし溶媒の加熱還流温度 (無溶媒の場合は -30°C ないし 150°C) の反応温度で行われる。

塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基；ピリジン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N, N-ジエチルアニリン等の有機塩基が挙げられる。触媒としては、例えば、4-ジメチルアミノピリジン、テトラブチルアンモニウムブロミド等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、蟻酸エチル、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン類；テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類；ベンゼン、トルエン、モノクロロベンゼン、1, 2-ジクロロベンゼン等の置換又は非置換ベンゼン類；N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類；メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水等を挙げることができ、これらの溶媒を単独、混合あるいは2相系の溶媒として用いることができる。

次に、得られた式 (20) の化合物 (R^5 、 R^6 及びZは一般式 (I) における定義と同義である。) のアセチル基を加水分解することにより、式 (21) で表される化合物 (R^5 、 R^6 及びZは一般式 (I) における定義と同義である。) を製造することができる。なお、式 (21) で表される化合物は、一般式 (I) に包含される化合物である。この反応は、酸あるいは塩基の存在下、無溶媒又は溶媒中 0°C から溶媒の加熱還流温度 (無溶媒の場合は 0°C ないし 150°C) の反応温度で行われる。

酸としては、例えば、塩酸、硫酸等の鉱酸；テトラフルオロホウ酸トリエチルオキソニウム等のルイス酸が挙げられる。塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、金属ナトリウム等の無機塩基；ヒドラジン等の有機塩基等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類；メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール等のアルコール類；水等を挙げることができ、これらの溶媒を単独あるいは混合溶媒として用いることができる。

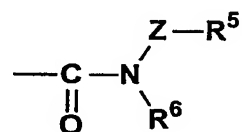
次に、得られた式(21)の化合物(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)とアシル化剤(5)(Aはアシル基を示し、Wはハロゲン原子；アセトキシ基、ベンゾイルオキシ基、メタンスルホニルオキシ基、トシル基等のアシルオキシ基；(2, 5-ジオキソピロリジン-1-イル)オキシ基等のイミドオキシ基；1-イミダゾリル基；ヒドロキシ基等を示す。)を反応させることにより、一般式(I)に包含される化合物である、式(22)の化合物(A、 R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)を製造することができる。この反応は、塩基及び／又はアシル化補助剤の存在又は非存在下、無溶媒又は溶媒中、 -30°C ないし溶媒の加熱還流温度(無溶媒の場合は -30°C ないし 150°C)の反応温度で行われる。

塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基；ピリジン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N, N-ジエチルアニリン等の有機塩基が挙げられる。アシル化補助剤としては、例えば、4-ジメチルアミノピリジン、テトラブチルアンモニウムブロミド等の触媒；塩化チオニル、オキシ塩化リン、三塩化リン、クロロ蟻酸エチル、4-ニトロベンゼンスルホニルクロリド等のハロゲン化合物；N, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]-3-エチルカルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、

蟻酸エチル、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン類；テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類；ベンゼン、トルエン、モノクロロベンゼン、1, 2-ジクロロベンゼン等の置換又は非置換ベンゼン類；N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類；メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水等を挙げることができ、これらの溶媒を単独、混合あるいは2相系の溶媒として用いることができる。

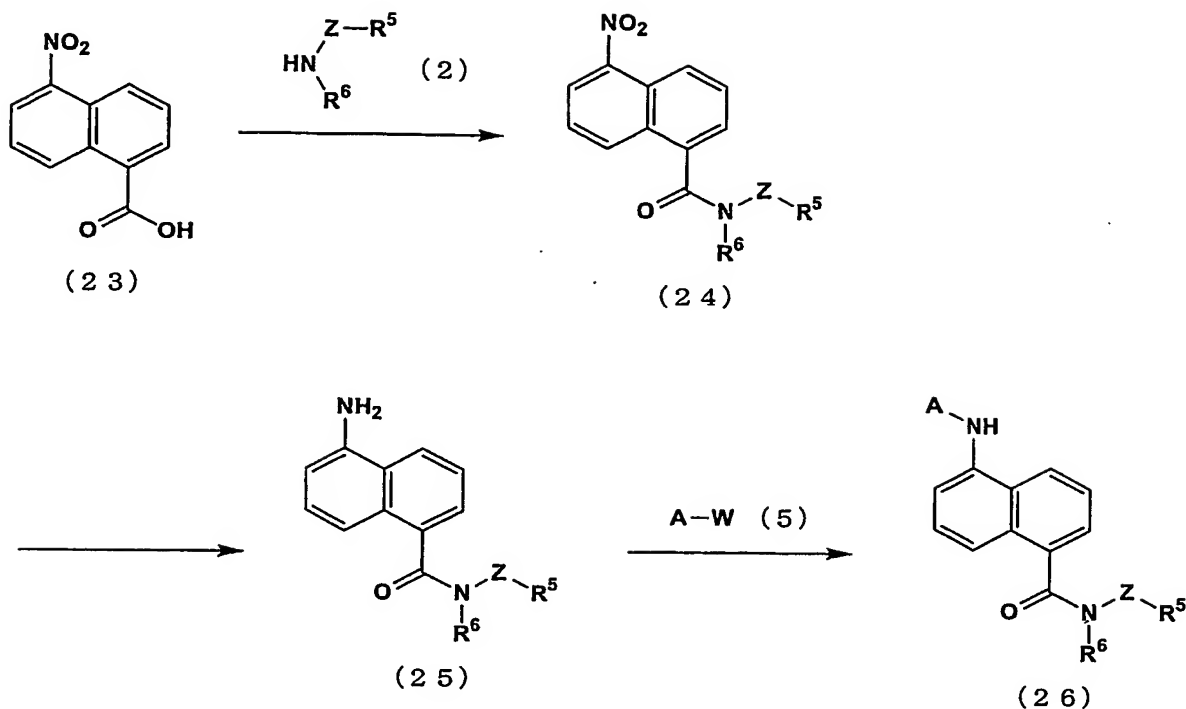
《製造法6》

本発明の一般式（I）で表される化合物において、 R^1 が式： $-NH-A$ （式中、Aは水素原子又はアシル基を示す）で表される基であり、 R^2 が水素原子であり、 R^3 が下記式：



（式中、 R^5 は置換基を有していてもよい環式基を示し、Zは単結合又は置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_4$ のアルキレン基を示し、ここで、該Zが置換基を有する場合、該置換基は R^5 と結合して環式基を形成してもよく、 R^6 は水素原子又は置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基を示し、ここで、 R^6 はZ又は R^5 と結合して環式基を形成してもよい。）で表される基であり、 R^4 が水素原子である化合物は、例えば、反応工程式6に示す方法によって製造することができる。

<反応工程式6>



5-ニトロナフタレン-1-カルボン酸 (23) は、例えば、テトラヘドロン (Tetrahedron)、第49巻、第17号、3655-3663ページ(1993年発行)に開示された製造法に従って製造できる。アミン (2) (R^5 、 R^6 及びZは一般式 (I) における定義と同義である。) は、《製造法1》において示した方法で入手可能である。

まず、5-ニトロナフタレン-1-カルボン酸 (23) とアミン (2) (R^5 、 R^6 及びZは一般式 (I) における定義と同義である。) とを反応させることにより、式 (24) の化合物 (R^5 、 R^6 及びZは一般式 (I) における定義と同義である。) を製造することができる。アシル化補助剤及び塩基の存在下、無溶媒又は溶媒中、 -30°C ないし溶媒の加熱還流温度 (無溶媒の場合は -30°C ないし 150°C) の反応温度で行われる。

アシル化補助剤としては、塩化チオニル、オキシ塩化リン、三塩化リン、クロロ蟻酸エチル、4-ニトロベンゼンスルホニルクロリド等のハロゲン化物；N，N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-[3-(ジメチルアミノ)プロピ

ル] - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類；カルボニルジイミダゾール等が挙げられる。塩基としては、例えば、ピリジン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N, N - ジエチルアニリン、4 - ジメチルアミノピリジン等の有機塩基が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、蟻酸エチル、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン類；テトラヒドロフラン、1, 2 - ジメトキシエタン、1, 4 - ジオキサン等のエーテル類；ベンゼン、トルエン、モノクロロベンゼン、1, 2 - ジクロロベンゼン等の置換又は非置換ベンゼン類；N, N - ジメチルホルムアミド、N - メチルピロリドン等のアミド類；メタノール、エタノール、1 - プロパノール、2 - プロパノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水等を挙げることができ、これらの溶媒を単独、混合あるいは2相系の溶媒として用いることができる。

次に、得られた式(24)の化合物(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)のニトロ基を還元することにより、式(25)で表される化合物(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)を製造することができる。なお、式(25)で表される化合物は、一般式(I)に包含される化合物である。この反応は、還元剤及び、酸若しくは塩基の存在又は非存在下、無溶媒又は溶媒中0℃から溶媒の加熱還流温度(無溶媒の場合は0℃ないし150℃)の反応温度で行われる。

還元剤としては、例えば、パラジウム炭素、パラジウム黒、水酸化パラジウム、酸化白金、ラネーニッケル等の貴金属類；ナトリウム、リチウム、アルミニウム、鉄、錫、亜鉛等の単体金属；塩化第二錫等の金属塩等が挙げられる。酸としては、例えば、塩酸、硫酸等の鉱酸；蟻酸、酢酸等の有機酸等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、ピリジン、キノリン等の有機塩基等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、例え、蟻酸エチル、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；テト

ラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類；メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール等のアルコール類；水等を挙げることができ、これらの溶媒を単独あるいは混合溶媒として用いることができる。

次に、得られた式(25)の化合物(R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)とアシル化剤(5)(Aはアシル基を表し、Wはハロゲン原子；アセトキシ基、ベンゾイルオキシ基、メタンスルホニルオキシ基、トシル基等のアシルオキシ基；(2, 5-ジオキソピロリジン-1-イル)オキシ基等のイミドオキシ基；1-イミダゾリル基；ヒドロキシ基等を表す。)を反応させることにより、一般式(I)に包含される化合物である、式(26)の化合物(A、 R^5 、 R^6 及びZは一般式(I)における定義と同義である。)を製造することができる。この反応は、塩基及び／又はアシル化補助剤の存在又は非存在下、無溶媒又は溶媒中、 -30°C ないし溶媒の加熱還流温度(無溶媒の場合は -30°C ないし 150°C)の反応温度で行われる。

塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基；ピリジン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N, N-ジエチルアニリン等の有機塩基が挙げられる。アシル化補助剤としては、例えば、4-ジメチルアミノピリジン、テトラブチルアンモニウムブロミド等の触媒；塩化チオニル、オキシ塩化リン、三塩化リン、クロロ蟻酸エチル、4-ニトロベンゼンスルホニルクロリド等のハロゲン化合物；N, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]-3-エチルカルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類等が挙げられる。溶媒としては、反応を阻害しない限りいかなるものでもよく、例えば、蟻酸エチル、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン類；テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類；ベンゼン、トルエン、モノクロロベンゼン、1, 2-ジクロロベンゼン等の置換又は非置換ベンゼ

ン類；N，N－ジメチルホルムアミド、N－メチルピロリドン等のアミド類；メタノール、エタノール、1－プロパノール、2－プロパノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水等を挙げることができ、これらの溶媒を単独、混合あるいは2相系の溶媒として用いることができる。

一般式（I）で表される化合物の塩の製造法としては、例えば、前記式（3）、（8）、（12）、（16）及び（20）の加水分解反応、あるいは前記式（24）の還元反応により直接塩を製造する方法；当該加水分解反応又は還元反応により一旦、一般式（I）で表される化合物の遊離体を製造した後、この遊離体を塩に変換する製造法などが挙げられ、いずれも当業者に容易に理解される方法である。

本明細書の実施例には、一般式（I）に包含される代表的化合物の製造方法が具体的に説明されている。従って、当業者は、上記の一般的な製造方法の説明及び実施例の具体的製造方法の説明を参照しつつ、適宜の反応原料、反応試薬、反応条件を選択し、必要に応じてこれらの方法に適宜の修飾ないし改変を加えることによって、一般式（I）に包含される化合物をいずれも製造可能である。

本発明の医薬は、DNA損傷を作用機序とする癌治療、例えばDNA損傷を惹起する抗癌剤による癌化学療法や癌放射線療法の効果増強のために用いることができる。DNA損傷を惹起する抗癌剤の代表例としては、例えば、ブレオマイシン、アドリアマイシン、シスプラチン、シクロフォスファミド、マイトマシンCなどを挙げることができるが、これらの誘導体のほか、DNA損傷を作用機序として含む制癌剤はいずれも本発明の医薬の適用対象となる。本発明の医薬は、DNA損傷を惹起する抗癌剤による癌化学療法又は癌放射線療法のいずれかを単独で行う場合のほか、これらの療法を組み合わせで行う癌療法において使用してもよい。

本発明の医薬の有効成分としては、上記一般式（I）で表される化合物又は薬理的に許容されるその塩の水和物又は溶媒和物を用いてもよい。又、不斉炭素を含む化合物については、純粋な形態の光学活性体又は光学活性体の任意の混合物、あるいはラセミ体のいずれを用いてもよい。本発明の医薬の有効成分として

は、上記化合物及び薬理学的に許容される塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる１種又は２種以上を用いることができる。

本発明の医薬としては、上記物質それ自体を投与してもよいが、好ましくは、当業者に周知の方法によって製造可能な経口用あるいは非経口用の医薬組成物として投与することができる。経口投与に適する医薬用組成物としては、例えば、錠剤、カプセル剤、散剤、細粒剤、顆粒剤、液剤、及びシロップ剤等を挙げることができ、非経口投与に適する医薬用組成物としては、例えば、注射剤、坐剤、吸入剤、点眼剤、点鼻剤、軟膏剤、経皮吸収剤、経粘膜吸収剤、クリーム剤、及び貼付剤等を挙げることができる。

上記の医薬組成物は、薬理学的、製剤学的に許容し得る添加物を加えて製造することができる。薬理学的、製剤学的に許容し得る添加物の例としては、例えば、賦形剤、崩壊剤ないし崩壊補助剤、結合剤、滑沢剤、コーティング剤、色素、希釈剤、基剤、溶解剤ないし崩壊補助剤、等張化剤、pH調節剤、安定化剤、噴射剤、及び粘着剤等を挙げることができる。上記の医薬組成物には、DNA損傷を作用機序とする制癌剤を１種又は２種以上配合してもよい。

本発明の医薬の投与量は特に限定されず、有効成分の種類や癌治療の種類などに応じて適宜選択することができ、さらに患者の体重や年齢、疾患の種類や症状、投与経路など通常考慮すべき種々の要因に応じて、適宜増減することができる。一般的には、経口投与の場合には、成人一日あたり0.01mg～1,000mg程度の範囲で用いることができる。

実施例

以下、実施例により本発明をさらに具体的に説明するが、本発明の範囲は下記の実施例に限定されることはない。

例１：N-ベンジル-5-[[（4-メチルフェニル）スルホニル]オキシ]ナフタレン-1-スルホンアミド（化合物番号1-1）の製造

（１）5-[[（4-メチルフェニル）スルホニル]オキシ]ナフタレン-1-ス

ルホニルクロリドの製造

米国特許第 5 3 7 8 7 1 5 号に開示された製造法に従って製造した。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): δ 2.46 (3H, s), 7.33–7.35 (3H, m), 7.59 (1H, dd, $J=8.4$, 7.8 Hz), 7.70 (1H, dd, $J=8.4$, 7.8 Hz), 7.79 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 8.38 (1H, dd, $J=7.8$, 1.2 Hz), 8.40 (1H, dd, $J=8.4$, 0.9 Hz), 8.70 (1H, d, $J=8.7$ Hz).

(2) N-ベンジル-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミドの製造

ベンジルアミン (117.9 mg, 1.1 mmol) をテトラヒドロフラン (5 ml) に溶かし、トリエチルアミン (0.17 ml, 1.2 mmol) を加え、氷浴で冷却した後、5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホニルクロリド (396.9 mg, 1.2 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応混合物を希塩酸にあげ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧留去して得られた残渣をシリカゲルカラム (展開溶媒; n-ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) で精製し、結晶化 (酢酸エチル/ヘキサン) して標題化合物の白色結晶 (398.8 mg, 85.3%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$): δ 2.41 (3H, s), 4.04 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 7.06–7.14 (5H, m), 7.35 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 7.47 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.61 (1H, dd, $J=8.4$, 7.2 Hz), 7.69 (1H, dd, $J=8.4$, 8.1 Hz), 7.85 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 8.10 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.13 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 8.61 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.64 (1H, t, $J=6.0$ Hz).

例 2～例 27: 以下の化合物を例 1 (2) と同様の製造法により製造した。

例2 (化合物1-2) 収率89.0%

(DMSO- d_6): δ 2.41 (3H, s), 4.07 (2H, d, $J=5.7$ Hz), 6.74 (2H, t, $J=7.8$ Hz), 7.10-7.20 (1H, m), 7.31 (1H, dd, $J=7.8, 0.9$ Hz), 7.48 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.59 (1H, dd, $J=8.4, 7.2$ Hz), 7.64 (1H, dd, $J=8.7, 7.8$ Hz), 7.84 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 8.08 (1H, ddd, $J=8.7, 7.5, 1.2$ Hz), 8.53 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.66 (1H, t, $J=5.7$ Hz).

例3 (化合物1-3) 収率86.9%

(DMSO- d_6): δ 2.41 (3H, s), 4.11 (2H, d, $J=5.7$ Hz), 7.18 (1H, dd, $J=8.4, 2.1$ Hz), 7.27 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 7.34-7.37 (2H, m), 7.47 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.59 (1H, dd, $J=8.4, 7.5$ Hz), 7.69 (1H, dd, $J=8.4, 8.1$ Hz), 7.84 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 8.08 (1H, d, $J=3.0$ Hz), 8.11 (1H, s), 8.58 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 8.73 (1H, t, $J=5.7$ Hz).

例4 (化合物1-4) 収率98.5

(DMSO- d_6): δ 2.42 (3H, s), 4.03 (2H, d, $J=7.2$ Hz), 7.28 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 7.33 (1H, dd, $J=8.7, 7.5$ Hz), 7.46-7.49 (3H, m), 7.57 (1H, dd, $J=8.4, 7.5$ Hz), 7.68 (1H, dd, $J=8.7, 7.5$ Hz), 7.85 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.89-7.91 (2H, m), 8.05 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.12 (1H, dd, $J=7.2, 1.2$ Hz), 8.56 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.86 (1H, t, $J=6.3$ Hz).

例5 (化合物1-5) 収率90.9%

(DMSO- d_6): δ 2.42 (3H, s), 4.19 (2H, d, $J=6.$

3 Hz), 7.32 (1H, dd, $J=7.8, 0.9$ Hz), 7.37 (2H, d, $J=9.0$ Hz), 7.48 (2H, dd, $J=8.7, 0.9$ Hz), 7.62 (1H, dd, $J=8.4, 7.2$ Hz), 7.70 (1H, dd, $J=8.4, 7.8$ Hz), 7.85 (2H, d, $J=8.1$ Hz), 7.99 (2H, d, $J=8.7$ Hz), 8.10 (1H, dt, $J=8.7, 0.9$ Hz), 8.14 (1H, dd, $J=7.5, 1.2$ Hz), 8.58 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.85 (1H, t, $J=6.3$ Hz).

例6 (化合物1-6) 收率83.3%

(DMSO- d_6): δ 2.03 (3H, s), 2.41 (3H, s), 4.00 (2H, d, $J=5.7$ Hz), 6.94-7.00 (2H, m), 7.06 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 7.37 (1H, d, $J=7.2$ Hz), 7.47 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.61 (1H, dd, $J=8.7, 7.2$ Hz), 7.69 (1H, dd, $J=8.7, 7.8$ Hz), 7.85 (2H, d, $J=8.1$ Hz), 8.10 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.12 (1H, dd, $J=6.3, 1.2$ Hz), 8.46 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 8.64 (1H, d, $J=8.4$ Hz).

例7 (化合物1-7) 收率77.3%

(DMSO- d_6): δ 1.19 (9H, s), 2.40 (3H, s), 3.98 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 6.97 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.12 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.34 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.46 (2H, d, $J=8.1$ Hz), 7.59 (1H, dd, $J=8.4, 7.5$ Hz), 7.68 (1H, dd, $J=8.7, 7.8$ Hz), 7.84 (2H, d, $J=8.7$ Hz), 8.08 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 8.11 (1H, d, $J=7.2$ Hz), 8.57 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 8.60 (1H, d, $J=8.7$ Hz).

例8 (化合物1-8) 收率86.1%

(CDCl₃): δ 2.44 (3H, s), 4.28 (2H, d, $J=6.6$ Hz)

z), 5.00 (1H, t, $J=6.6$ Hz), 7.29–7.34 (6H, m), 7.48 (1H, dd, $J=8.4, 7.5$ Hz), 7.50–7.53 (1H, m), 7.55 (1H, dd, $J=9.0, 7.5$ Hz), 7.76 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 8.19 (1H, dt, $J=8.7, 1.2$ Hz), 8.25 (1H, dd, $J=7.5, 1.2$ Hz), 8.51 (1H, dt, $J=9.0, 0.9$ Hz).

例9 (化合物1-9) 収率93.3%

(DMSO- d_6): δ 2.41 (3H, s), 4.14 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 7.30 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.34 (1H, dd, $J=7.5, 0.6$ Hz), 7.47 (4H, d, $J=8.7$ Hz), 7.60 (1H, dd, $J=8.7, 7.5$ Hz), 7.70 (1H, dd, $J=8.7, 7.5$ Hz), 7.84 (2H, d, $J=8.1$ Hz), 8.09 (1H, d, $J=8.4$ Hz), 8.12 (1H, dd, $J=7.5, 1.2$ Hz), 8.58 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.77 (1H, t, $J=6.3$ Hz).

例10 (化合物1-10) 収率36.9

(CDCl₃): δ 2.47 (3H, s), 3.97 (2H, d, $J=5.7$ Hz), 5.03 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 5.49 (2H, s), 6.24 (1H, d, $J=2.4$ Hz), 6.34 (1H, dd, $J=8.1, 2.1$ Hz), 6.54 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.24 (1H, dd, $J=7.2, 1.2$ Hz), 7.37 (2H, dd, $J=8.7, 0.9$ Hz), 7.49–7.54 (2H, m), 7.884 (2H, dt, $J=8.4, 1.8$ Hz), 8.22–8.26 (2H, m), 8.52 (1H, d, $J=8.7$ Hz).

例11 (化合物1-11) 収率88.1%

(CDCl₃): δ 2.44 (3H, s), 3.35 (3H, s), 4.12 (2H, d, $J=6.9$ Hz), 5.45 (1H, t, $J=6.6$ Hz), 6.33 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 6.59 (1H, td, $J=7.5, 0.9$ Hz), 6.79 (1H, dd, $J=7.5, 1.8$ Hz), 6.97 (1H, td, $J=$

7. 8, 1. 8 Hz), 7. 28-7. 35 (4H, m), 7. 51 (1H, t, J=8. 4 Hz), 7. 77 (2H, d, J=8. 1 Hz), 8. 02 (1H, d, J=8. 4, 0. 9 Hz), 8. 06 (1H, dd, J=7. 5, 1. 2 Hz), 8. 45 (1H, d, J=9. 0 Hz).

例12 (化合物1-12) 收率86. 6%

(DMSO-d₆): δ 2. 41 (3H, s), 3. 53 (3H, s), 4. 02 (2H, d, J=6. 3 Hz), 6. 60-6. 67 (3H, m), 7. 02 (1H, t, J=8. 1 Hz), 7. 34 (1H, dd, J=7. 8, 1. 2 Hz), 7. 47 (2H, d, J=8. 4 Hz), 7. 60 (1H, dd, J=8. 7, 7. 5 Hz), 7. 69 (1H, dd, J=8. 7, 8. 1 Hz), 7. 85 (2H, d, J=8. 4 Hz), 8. 09 (1H, d, J=8. 4 Hz), 8. 12 (1H, dd, J=7. 2, 0. 9 Hz), 8. 61 (1H, d, J=8. 7 Hz), 8. 64 (1H, t, J=6. 0 Hz).

例13 (化合物1-13) 收率89. 7%

(DMSO-d₆): δ 2. 41 (3H, s), 3. 52 (3H, s), 3. 73 (3H, s), 4. 03 (2H, d, J=6. 0 Hz), 6. 71 (1H, dd, J=6. 9, 2. 1 Hz), 6. 79-6. 86 (2H, m), 7. 35 (1H, d, J=8. 1 Hz), 7. 47 (2H, d, J=8. 1 Hz), 7. 63 (1H, dd, J=8. 4, 7. 5 Hz), 7. 69 (1H, dd, J=8. 4, 8. 1 Hz), 7. 85 (2H, d, J=8. 4 Hz), 8. 11 (1H, d, J=8. 4 Hz), 8. 15 (1H, d, J=7. 2 Hz), 8. 48 (1H, t, J=6. 0 Hz), 8. 63 (1H, d, J=8. 7 Hz).

例14 (化合物1-14) 收率94. 2%

(CDCl₃): δ 2. 44 (3H, s), 3. 60 (6H, s), 4. 04 (2H, d, J=6. 3 Hz), 4. 93 (1H, t, J=5. 4 Hz), 6. 14 (2H, d, J=2. 1 Hz), 6. 24 (1H, t, J=2. 1 Hz), 7. 29-7. 33 (3H, m), 7. 48 (1H, dd, J=8. 4, 7. 5 Hz), 7.

5.6 (1H, t, $J=8.4$ Hz), 7.78 (2H, d, $J=8.7$ Hz), 8.19 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.26 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 8.57 (1H, d, $J=8.7$ Hz).

例15 (化合物1-15) 收率94.4%

(DMSO- d_6): δ 2.41 (3H, s), 3.94 (2H, d, $J=6.3$ Hz), 5.89 (2H, s), 6.50 (1H, dd, $J=8.1, 1.5$ Hz), 6.57 (1H, d, $J=1.2$ Hz), 6.62 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 7.33 (1H, dd, $J=7.8, 0.9$ Hz), 7.47 (2H, d, $J=7.8$ Hz), 7.61 (1H, dd, $J=8.7, 7.2$ Hz), 7.68 (1H, dd, $J=8.7, 7.8$ Hz), 7.84 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 8.09 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.11 (1H, dd, $J=7.5, 1.2$ Hz), 8.55 (1H, t, $J=6.3$ Hz), 8.58 (1H, d, $J=9.0$ Hz).

例16 (化合物1-16) 收率85.4%

(DMSO- d_6): δ 2.41 (3H, s), 3.84 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 5.02 (2H, s), 6.23 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 6.37 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 6.42 (1H, s), 6.81 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 7.35 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.47 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.64 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.69 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 7.85 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 8.11-8.15 (2H, m), 8.50 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 8.63 (1H, d, $J=8.7$ Hz).

例17 (化合物1-17) 收率88.3%

(DMSO- d_6): δ 2.40 (3H, s), 2.80 (6H, s), 3.89 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 6.47 (2H, d, $J=8.7$ Hz), 6.86 (2H, d, $J=8.7$ Hz), 7.34 (1H, dd, $J=7.8, 0.9$ Hz), 7.46 (2H, d, $J=8.1$ Hz), 7.61 (1H, dd, $J=8.$

7, 7. 2 Hz), 7. 6 8 (1H, d d, J=8. 7, 7. 5 Hz), 7. 8 4 (2H, d, J=8. 4 Hz), 8. 0 8-8. 1 4 (2H, m), 8. 4 2 (1H, t, J=6. 0 Hz), 8. 6 0 (1H, d, J=8. 7 Hz).

例18 (化合物1-18) 収率86. 9%

(DMSO-d₆): δ 2. 4 1 (3H, s), 3. 1 4 (3H, s), 4. 1 6 (2H, d, J=6. 3 Hz), 7. 3 5 (1H, d, J=7. 2 Hz), 7. 3 7 (2H, d, J=8. 1 Hz), 7. 4 8 (2H, d, J=8. 4 Hz), 7. 6 2 (1H, d d, J=8. 7, 7. 5 Hz), 7. 7 0 (2H, d, J=8. 1 Hz), 7. 7 6 (1H, t, J=4. 8 Hz), 7. 8 5 (2H, d, J=8. 4 Hz), 8. 1 1-8. 1 4 (2H, m), 8. 6 0 (1H, d, J=8. 7 Hz), 8. 8 1 (1H, t, J=6. 3 Hz).

例19 (化合物1-19) 収率87. 1%

(DMSO-d₆): δ 2. 4 0 (3H, s), 4. 4 7 (2H, d, J=5. 7 Hz), 7. 2 8-7. 3 4 (4H, m), 7. 4 2 (1H, d, J=7. 5 Hz), 7. 4 7 (2H, d, J=8. 1 Hz), 7. 5 8 (1H, d d, J=8. 4, 7. 2 Hz), 7. 6 4 (1H, d d, J=8. 7, 7. 8 Hz), 7. 7 6 (1H, d d, J=7. 5, 1. 8 Hz), 7. 8 3-7. 8 9 (4H, m), 8. 0 8 (1H, d, J=8. 4 Hz), 8. 1 3 (1H, d d, J=7. 2, 0. 9 Hz), 8. 6 2 (1H, d, J=8. 7 Hz), 8. 6 5 (1H, t, J=5. 4 Hz).

例20 (化合物1-20) 収率87. 9%

(DMSO-d₆): δ 1. 8 2 (3H, s), 2. 4 2 (3H, s), 4. 0 1 (2H, d, J=6. 0 Hz), 5. 6 5 (1H, d d, J=3. 0, 1. 2 Hz), 5. 7 9 (1H, d, J=3. 0 Hz), 7. 3 3 (1H, d d, J=7. 5, 0. 9 Hz), 7. 4 8 (2H, d, J=8. 7 Hz), 7. 6 1 (1H, d d, J=8. 7, 7. 8 Hz), 7. 6 7 (1H, d d, J=8. 7, 7. 8 Hz), 7. 8 6 (2H, d, J=8. 7 Hz), 8. 0 9 (1H, t, J=7. 8 Hz), 8.

1.0 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 8.55–8.61 (2H, m).

例 2.1 (化合物 1-2.1) 收率 91.9%

(DMSO- d_6): δ 2.41 (3H, s), 4.14 (2H, d, $J=6.3$ Hz), 7.08–7.16 (2H, m), 7.35 (1H, d, $J=7.2$ Hz), 7.48 (2H, d, $J=8.1$ Hz), 7.50–7.55 (1H, m), 7.59 (1H, dd, $J=8.7, 7.5$ Hz), 7.70 (1H, t, $J=8.1$ Hz), 7.85 (2H, d, $J=8.7$ Hz), 8.09 (1H, d, $J=8.4$ Hz), 8.12 (1H, dd, $J=7.5, 1.2$ Hz), 8.23–8.26 (1H, m), 8.62 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.76 (1H, t, $J=6.3$ Hz).

例 2.2 (化合物 1-2.2) 收率 93.7%

(DMSO- d_6): δ 2.41 (3H, s), 4.22 (2H, d, $J=5.7$ Hz), 7.12 (1H, d, $J=2.7$ Hz), 7.14 (1H, d, $J=3.0$ Hz), 7.34 (1H, d, $J=7.2$ Hz), 7.42 (1H, d, $J=3.6$ Hz), 7.44 (1H, d, $J=3.6$ Hz), 7.47 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.62 (1H, dd, $J=8.7, 7.5$ Hz), 7.70 (1H, dd, $J=8.7, 7.8$ Hz), 7.84 (2H, d, $J=8.7$ Hz), 8.10 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.19 (1H, dd, $J=7.2, 0.9$ Hz), 8.64 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.83 (1H, t, $J=5.7$ Hz).

例 2.3 (化合物 1-2.3) 收率 88.7%

(DMSO- d_6): δ 0.61–0.72 (2H, m), 0.95–1.04 (3H, m), 1.19 (1H, bs), 1.49–1.52 (5H, m), 2.40 (3H, s), 2.61 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 7.46 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.46 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.66 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 7.70 (1H, dd, $J=8.7, 7.8$ Hz), 7.84 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 8.04 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 8.1

4 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.62 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$).

例24 (化合物1-24) 收率87.8%

(CDCl₃): δ 2.42 (3H, s), 6.67 (1H, s), 6.88-6.91 (2H, m), 7.07-7.19 (2H, m), 7.25-7.27 (3H, m), 7.33-7.38 (2H, m), 7.57 (1H, dd, $J=8.7, 7.8\text{ Hz}$), 7.72 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 8.12 (1H, dt, $J=7.8, 0.9\text{ Hz}$), 8.16 (1H, dd, $J=7.5, 1.2\text{ Hz}$), 8.58 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$).

例25 (化合物1-25) 收率98.3%

(DMSO-d₆): δ 2.36 (3H, s), 2.57 (2H, t, $J=7.2\text{ Hz}$), 3.00-3.06 (2H, m), 7.00 (2H, dd, $J=8.1, 2.1\text{ Hz}$), 7.10-7.18 (3H, m), 7.37 (2H, d, $J=7.5\text{ Hz}$), 7.43 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.63 (1H, dd, $J=8.4, 7.2\text{ Hz}$), 7.68 (1H, t, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.83 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 8.12 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.13 (1H, $J=7.5\text{ Hz}$), 8.18 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 8.57 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$).

例26 (化合物1-26) 收率81.5%

(DMSO-d₆): δ 1.15 (3H, d, $J=6.9\text{ Hz}$), 2.40 (3H, s), 4.26-4.36 (1H, m), 6.90-6.97 (5H, m), 7.34 (1H, d, $J=7.2\text{ Hz}$), 7.45 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.48 (1H, dd, $J=8.7, 7.5\text{ Hz}$), 7.67 (1H, t, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.82 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.99 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.01 (1H, d, $J=7.5\text{ Hz}$), 8.58 (1H, d, $J=3.0\text{ Hz}$), 8.60 (1H, d, $J=2.7\text{ Hz}$).

例27 (化合物1-27) 收率53.6%

(CDCl₃): δ 2.43 (3H, s), 2.70 (3H, s), 4.33 (2

H, s), 7.19–7.22 (2H, m), 7.27–7.34 (6H, m), 7.52 (1H, dd, $J=8.7, 7.8$ Hz), 7.57 (1H, dd, $J=8.7, 7.8$ Hz), 7.78 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 8.21–8.25 (2H, m), 8.72 (1H, d, $J=8.4$ Hz).

例28：N-ベンジル-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド（化合物番号2-1）の製造

N-ベンジル-5-[(4-メチルフェニル)スルホニル]オキシナフタレン-1-スルホンアミド（化合物番号1-1；298.8mg, 0.64mmol）にメタノール（5ml）、5規定水酸化ナトリウム溶液（0.65ml）を加え、65℃で1時間攪拌した。室温まで冷却後、反応混合物を希塩酸にあげ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧留去して得られた残渣をシリカゲルカラム（展開溶媒；n-ヘキサン：酢酸エチル=3：2→1：1）で精製して標題化合物の薄褐色結晶（152.8mg, 76.2%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6): δ 4.00 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 7.00 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 7.14–7.22 (5H, m), 7.49 (1H, dd, $J=8.7, 7.5$ Hz), 7.52 (1H, dd, $J=8.1, 7.5$ Hz), 8.08–8.11 (2H, m), 8.42 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 8.43 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 10.49 (1H, s).

例29～例53：以下の化合物を例28と同様の製造法により製造した（原料は、例2～例9及び例11～例27で製造した化合物である）。

例29（化合物2-2）収率76.2%

(DMSO- d_6): δ 4.05 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 6.83 (2H, t, $J=7.8$ Hz), 6.97 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.16–7.27 (1H, m), 7.43 (1H, t, $J=8.7$ Hz), 7.49 (1H, dd, $J=8.1, 7.5$ Hz), 8.01 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.

0.6 (1H, dd, $J=7.2, 1.2$ Hz), 8.38 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 8.41 (1H, t, $J=5.7$ Hz), 10.43 (1H, s).

例30 (化合物2-3) 收率76.1%

(DMSO- d_6): δ 4.08 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 7.00 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.21 (1H, dd, $J=8.4, 2.4$ Hz), 7.33 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 7.41 (1H, d, $J=1.8$ Hz), 7.45-7.53 (2H, m), 8.04 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 8.07 (1H, dd, $J=7.2, 1.2$ Hz), 8.40 (1H, d, $J=8.4$ Hz), 8.53 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 10.49 (1H, s).

例31 (化合物2-4) 收率69.4%

(DMSO- d_6): δ 4.17 (2H, d, $J=6.3$ Hz), 6.95 (1H, d, $J=7.2$ Hz), 7.37 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 7.43-7.52 (3H, m), 7.89-7.94 (2H, m), 8.02 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.06 (1H, dd, $J=7.5, 1.2$ Hz), 8.34 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.63 (1H, t, $J=6.3$ Hz), 10.45 (1H, s).

例32 (化合物2-5) 收率48.5%

(DMSO- d_6): δ 4.15 (2H, d, $J=6.3$ Hz), 6.99 (1H, d, $J=7.2$ Hz), 7.39 (2H, d, $J=8.7$ Hz), 7.46-7.52 (2H, m), 7.99 (2H, d, $J=8.7$ Hz), 8.04 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.07 (1H, dd, $J=7.2, 1.2$ Hz), 8.38 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.63 (1H, t, $J=6.3$ Hz), 10.61 (1H, s).

例33 (化合物2-6) 收率73.6%

(DMSO- d_6): δ 2.09 (3H, s), 3.97 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 6.99-7.12 (4H, m), 7.15 (1H, d, $J=7.2$ Hz), 7.48 (1H, dd, $J=8.4, 7.8$ Hz), 7.52 (1H, dd,

$J=8.7, 7.5\text{ Hz}$), 8.09 (1H, dd, $J=7.2, 1.2\text{ Hz}$),
 8.11 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 8.52 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$),
 8.42 (1H, dt, $J=8.4, 1.2\text{ Hz}$), 10.48 (1H, s).

例34 (化合物2-7) 收率62.8%

(DMSO- d_6): δ 1.20 (9H, s), 3.95 (2H, d, $J=6.0\text{ Hz}$), 6.99 (1H, dd, $J=7.8, 0.6\text{ Hz}$), 7.03 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.15 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), $7.44-7.52$ (2H, m), $8.05-8.08$ (2H, m), 8.35 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 8.39 (1H, dd, $J=8.4, 1.2\text{ Hz}$), 10.46 (1H, s).

例35 (化合物2-8) 收率40.7%

(DMSO- d_6): δ 4.19 (2H, d, $J=5.7\text{ Hz}$), 7.01 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.38 (1H, t, $J=7.8\text{ Hz}$), $7.45-7.61$ (4H, m), $8.05-8.11$ (2H, m), 8.41 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 8.61 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 10.50 (1H, s).

例36 (化合物2-9) 收率79.6%

(DMSO- d_6): δ 4.10 (2H, d, $J=6.3\text{ Hz}$), 7.00 (1H, d, $J=6.9\text{ Hz}$), 7.36 (2H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), $7.46-7.52$ (4H, m), 8.05 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.07 (1H, dd, $J=7.5, 1.2\text{ Hz}$), 8.40 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 8.55 (1H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 10.60 (1H, s).

例37 (化合物2-11) 收率72.2%

(DMSO- d_6): δ 3.64 (3H, s), 3.98 (2H, d, $J=6.3\text{ Hz}$), $6.73-6.79$ (2H, m), 6.99 (1H, d, $J=7.2\text{ Hz}$), $7.10-7.19$ (2H, m), 7.48 (1H, t, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.50 (1H, t, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.06 (1H, dd, $J=7.5, 1.$

2 Hz), 8.09 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.17 (1H, t, $J=6.3$ Hz), 8.40 (1H, d, $J=8.4$ Hz), 10.46 (1H, s).

例38 (化合物2-12) 收率74.9%

(DMSO- d_6): δ 3.54 (3H, s), 4.00 (2H, d, $J=6.3$ Hz), 6.64-6.73 (3H, m), 7.00 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.08 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 7.46-7.53 (2H, m), 8.08 (1H, dd, $J=7.2, 1.5$ Hz), 8.09 (1H, d, $J=8.4$ Hz), 8.41 (1H, d, $J=7.2$ Hz), 8.42 (1H, t, $J=5.7$ Hz), 10.47 (1H, s).

例39 (化合物2-13) 收率63.1%

(DMSO- d_6): δ 3.56 (3H, s), 3.74 (3H, s), 4.00 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 6.81 (1H, dd, $J=6.0, 3.3$ Hz), 6.86-6.90 (2H, m), 7.00 (1H, dd, $J=7.5, 0.3$ Hz), 7.48 (1H, dd, $J=8.7, 7.5$ Hz), 7.53 (1H, dd, $J=8.4, 7.5$ Hz), 8.08-8.11 (2H, m), 8.27 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 8.42 (1H, d, $J=8.4$ Hz), 10.49 (1H, s).

例40 (化合物2-14) 收率60.8%

(DMSO- d_6): δ 3.52 (6H, s), 3.98 (2H, d, $J=6.3$ Hz), 6.21-6.24 (3H, m), 7.00 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.48 (1H, t, $J=8.7, 4.5$ Hz), 7.51 (1H, dd, $J=7.5, 3.9$ Hz), 8.08 (1H, dd, $J=5.7, 1.2$ Hz), 8.10 (1H, d, $J=5.7$ Hz), 8.40 (1H, d, $J=7.2$ Hz), 8.42 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 10.48 (1H, s).

例41 (化合物2-15) 收率70.3%

(DMSO- d_6): δ 3.91 (2H, d, $J=6.3$ Hz), 5.90 (2H, s), 6.57 (1H, dd, $J=7.8, 1.8$ Hz), 6.61 (1H,

d, $J=1.8\text{ Hz}$), 6.67 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 6.99 (1H, d, $J=7.2\text{ Hz}$), 7.48 (1H, dd, $J=9.0, 7.5\text{ Hz}$), 7.50 (1H, dd, $J=8.7, 7.5\text{ Hz}$), 8.04–8.07 (2H, m), 8.34 (1H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 8.40 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 10.46 (1H, s).

例42 (化合物2-16) 收率79.5%

(DMSO- d_6): δ 3.82 (2H, d, $J=6.3\text{ Hz}$), 5.04 (2H, s), 6.31 (1H, d, $J=7.2\text{ Hz}$), 6.40 (1H, dd, $J=8.1, 1.5\text{ Hz}$), 6.47 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$), 6.86 (1H, t, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.00 (1H, d, $J=7.2\text{ Hz}$), 7.48 (1H, dd, $J=8.4, 7.2\text{ Hz}$), 7.54 (1H, dd, $J=8.4, 7.5\text{ Hz}$), 8.09 (1H, dd, $J=7.2, 1.2\text{ Hz}$), 8.10 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.29 (1H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 8.43 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 10.48 (1H, s).

例43 (化合物2-17) 收率53.5%

(DMSO- d_6): δ 2.81 (6H, s), 3.86 (2H, d, $J=6.0\text{ Hz}$), 6.52 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 6.93 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 6.99 (1H, d, $J=7.5\text{ Hz}$), 7.47 (1H, dd, $J=8.7, 7.8\text{ Hz}$), 7.52 (1H, dd, $J=8.4, 7.5\text{ Hz}$), 8.06 (1H, d, $J=0.9\text{ Hz}$), 8.09 (1H, t, $J=1.2\text{ Hz}$), 8.20 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 8.40 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$).

例44 (化合物2-18) 收率57.9%

(DMSO- d_6): δ 3.13 (3H, s), 4.12 (2H, d, $J=6.3\text{ Hz}$), 7.00 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.37 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.47–7.52 (2H, m), 7.67 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 8.05 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.07 (1H, dd, $J=7.2, 1.2\text{ Hz}$), 8.39 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 8.59 (1H, t,

$J = 6.3 \text{ Hz}$), 10.50 (1H, s).

例45 (化合物2-19) 收率73.6%

(DMSO- d_6): δ 4.43 (2H, d, $J = 5.7 \text{ Hz}$), 7.00 (1H, d, $J = 7.8 \text{ Hz}$), 7.33-7.41 (3H, m), 7.43-7.50 (2H, m), 7.52 (1H, dd, $J = 8.4, 7.2 \text{ Hz}$), 7.80 (1H, dd, $J = 7.2, 1.8 \text{ Hz}$), 7.88 (1H, d, $J = 7.5 \text{ Hz}$), 7.93 (1H, d, $J = 8.4 \text{ Hz}$), 8.12 (1H, d, $J = 8.7 \text{ Hz}$), 8.14 (1H, dd, $J = 7.2, 1.2 \text{ Hz}$), 8.43 (1H, d, $J = 8.1 \text{ Hz}$), 8.44 (1H, t, $J = 5.4 \text{ Hz}$), 10.48 (1H, s).

例46 (化合物2-20) 收率55.0%

(DMSO- d_6): δ 1.93 (3H, s), 3.98 (2H, d, $J = 5.7 \text{ Hz}$), 5.73 (1H, dd, $J = 2.7, 1.2 \text{ Hz}$), 5.85 (1H, d, $J = 2.7 \text{ Hz}$), 6.98 (1H, d, $J = 7.2 \text{ Hz}$), 7.43-7.52 (2H, m), 8.01 (1H, d, $J = 1.2 \text{ Hz}$), 8.04-8.05 (1H, m), 8.35 (1H, t, $J = 6.0 \text{ Hz}$), 8.40 (1H, d, $J = 8.4 \text{ Hz}$), 10.44 (1H, s).

例47 (化合物2-21) 收率51.7%

(DMSO- d_6): δ 4.10 (2H, d, $J = 6.0 \text{ Hz}$), 7.00 (1H, d, $J = 7.5 \text{ Hz}$), 7.16 (1H, t, $J = 6.0 \text{ Hz}$), 7.25 (1H, d, $J = 7.8 \text{ Hz}$), 7.46-7.53 (2H, m), 7.60 (1H, t, $J = 7.5 \text{ Hz}$), 8.08 (2H, d, $J = 7.8 \text{ Hz}$), 8.34 (1H, d, $J = 3.9 \text{ Hz}$), 8.40 (1H, d, $J = 8.4 \text{ Hz}$), 8.53 (1H, t, $J = 6.0 \text{ Hz}$), 10.48 (1H, s).

例48 (化合物2-22) 收率57.6%

(DMSO- d_6): δ 4.17 (2H, d, $J = 6.0 \text{ Hz}$), 7.01 (1H, d, $J = 7.5 \text{ Hz}$), 7.13 (1H, d, $J = 3.0 \text{ Hz}$), 7.15 (1H, d, $J = 3.0 \text{ Hz}$), 7.46-7.52 (3H, m), 7.55 (1H,

dd, $J=8.4, 7.2\text{ Hz}$), 8.10 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.15 (1H, dd, $J=7.5, 1.2\text{ Hz}$), 8.44 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 8.60 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 10.52 (1H, s), 12.30 (1H, s).

例49 (化合物2-23) 收率67.0%

(CDCl₃): δ 0.68-0.81 (2H, m), 1.01-1.11 (3H, m), 1.26-1.34 (1H, m), 1.55-1.60 (5H, m), 2.70 (2H, t, $J=6.6\text{ Hz}$), 4.61 (1H, t, $J=6.6\text{ Hz}$), 5.72 (1H, s), 6.93 (1H, dd, $J=7.5, 0.6\text{ Hz}$), 7.48 (1H, dd, $J=8.7, 7.5\text{ Hz}$), 7.53 (1H, dd, $J=8.4, 7.8\text{ Hz}$), 8.17 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.27 (1H, dd, $J=7.2, 1.2\text{ Hz}$), 8.52 (1H, dd, $J=8.4, 1.2\text{ Hz}$).

例50 (化合物2-24) 收率51.8%

(CDCl₃): δ 6.92-7.02 (4H, m), 7.06-7.12 (2H, m), 7.37 (1H, dd, $J=8.7, 7.5\text{ Hz}$), 7.46 (1H, dd, $J=8.7, 7.8\text{ Hz}$), 8.16-8.23 (2H, m), 8.49 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 8.74 (1H, s), 9.41 (1H, bs).

例51 (化合物2-25) 收率63.9%

(DMSO-d₆): δ 2.36 (3H, s), 2.57 (2H, t, $J=7.2\text{ Hz}$), 3.00-3.06 (2H, m), 7.00 (2H, dd, $J=8.1, 2.1\text{ Hz}$), 7.10-7.18 (3H, m), 7.37 (2H, d, $J=7.5\text{ Hz}$), 7.43 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.63 (1H, dd, $J=8.4, 7.2\text{ Hz}$), 7.68 (1H, t, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.83 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 8.12 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.13 (1H, $J=7.5\text{ Hz}$), 8.18 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 8.57 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$).

例52 (化合物2-26) 收率57.8%

(CDCl₃): δ 1.33 (3H, d, J=6.9 Hz), 4.38–4.47 (1H, m), 4.98 (1H, d, J=7.2 Hz), 6.45 (1H, bs), 6.87–6.92 (3H, m), 6.95–7.03 (3H, m), 7.36 (1H, dd, J=8.4, 7.2 Hz), 7.42 (1H, dd, J=8.7, 7.5 Hz), 8.07–8.13 (2H, m), 8.41 (1H, dt, J=8.1, 1.2 Hz)

例53 (化合物2-27) 収率53.6%

(CDCl₃): δ 2.71 (3H, s), 4.44 (2H, s), 6.94 (2H, d, J=7.5 Hz), 7.21–7.33 (5H, m), 7.49 (1H, dd, J=8.7, 7.5 Hz), 7.55 (1H, dd, J=8.7, 7.5 Hz), 8.27 (1H, dd, J=7.5, 1.2 Hz), 8.36 (1H, d, J=8.7 Hz), 8.53–8.56 (1H, m).

例54: 5-アセチルオキシ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号3-1) の製造

(1) 5-(アセチルオキシ)ナフタレン-2-スルホニルクロリドの製造

テトラヘドロン (Tetrahedron)、第48巻、第42号、9207–9216 ページ (1992年発行)、及び日本国公開特許公報昭60-140240号に開示された製造法に従って製造した。

(2) 5-アセチルオキシ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミドの製造

ベンジルアミン (32.1 mg, 0.30 mmol) をテトラヒドロフラン (3 ml) に溶かし、トリエチルアミン (50 μl, 0.36 mmol)、5-(アセチルオキシ)ナフタレン-2-スルホニルクロリド (84.9 mg, 0.30 mmol) を加え、室温で30分間攪拌した。反応混合物を希塩酸にあげ酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧留去して得られた残渣をシリカゲルカラム (展開溶媒; n-ヘキサン: 酢

酸エチル=2:1→1:1)で精製して標題化合物の薄黄白色結晶(72.1mg, 67.6%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): δ 2.49 (3H, s), 4.16 (2H, d, $J=6.3\text{Hz}$), 4.92 (1H, t, $J=6.0\text{Hz}$), 7.16–7.26 (5H, m), 7.43 (1H, dd, $J=7.8, 1.2\text{Hz}$), 7.61 (1H, dd, $J=8.1, 7.8\text{Hz}$), 7.84 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.86 (1H, dd, $J=8.7, 1.8\text{Hz}$), 8.00 (1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 8.45 (1H, d, $J=2.1\text{Hz}$).

例55～例68:以下の化合物を例54(2)と同様の製造法により製造した。

例55 (化合物3-2) 収率88.5%

($\text{DMSO}-d_6$): δ 2.49 (3H, s), 4.10 (2H, d, $J=6.3\text{Hz}$), 7.34 (1H, dd, $J=8.4, 2.1\text{Hz}$), 7.44 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.47 (1H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 7.51 (1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 7.70 (1H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 7.86 (1H, dd, $J=8.7, 1.5\text{Hz}$), 8.08 (1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 8.12 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.44 (1H, t, $J=6.3\text{Hz}$), 8.48 (1H, s).

例56 (化合物3-3) 収率91.7%

($\text{DMSO}-d_6$): δ 2.48 (3H, s), 4.22 (2H, d, $J=6.3\text{Hz}$), 7.48–7.53 (2H, m), 7.66–7.72 (2H, m), 7.85 (1H, dd, $J=8.7, 1.5\text{Hz}$), 7.97–8.00 (1H, m), 8.04–8.11 (3H, m), 8.48 (1H, d, $J=1.5\text{Hz}$), 8.55 (1H, t, $J=6.3\text{Hz}$).

例57 (化合物3-4) 収率91.3%

(CDCl_3): δ 1.23 (9H, s), 2.49 (3H, s), 4.14 (2H, d, $J=6.3\text{Hz}$), 4.94 (1H, t, $J=6.3\text{Hz}$), 7.09 (2

H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.21–7.26 (2H, m), 7.42 (1H, dd, $J=7.8, 0.9\text{ Hz}$), 7.60 (1H, dd, $J=7.8, 7.5\text{ Hz}$), 7.83 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.84 (1H, dd, $J=9.0, 1.8\text{ Hz}$), 7.98 (1H, d, $J=9.3\text{ Hz}$), 8.44 (1H, d, $J=2.1\text{ Hz}$).

例58 (化合物3-5) 收率92.9%

(DMSO- d_6): δ 2.48 (3H, s), 4.15 (2H, s), 7.46 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.50 (1H, dd, $J=7.5, 1.5\text{ Hz}$), 7.58 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.69 (1H, t, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.86 (1H, dd, $J=9.0, 1.8\text{ Hz}$), 8.06 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 8.11 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.47 (2H, d, $J=1.5\text{ Hz}$).

例59 (化合物3-6) 收率92.8%

(CDCl₃): δ 2.48 (3H, s), 3.69 (3H, s), 3.72 (3H, s), 4.19 (2H, d, $J=6.6\text{ Hz}$), 5.20 (1H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 6.64 (2H, d, $J=7.5\text{ Hz}$), 6.77 (1H, dd, $J=8.7, 6.9\text{ Hz}$), 7.39 (1H, dd, $J=7.8, 1.2\text{ Hz}$), 7.58 (1H, dd, $J=8.4, 7.2\text{ Hz}$), 7.77–7.81 (2H, m), 7.90 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.35 (1H, d, $J=1.8\text{ Hz}$).

例60 (化合物3-7) 收率63.7%

(DMSO- d_6): δ 2.49 (3H, s), 3.83 (2H, d, $J=6.3\text{ Hz}$), 5.03 (2H, s), 6.35 (1H, d, $J=7.5\text{ Hz}$), 6.40 (1H, d, $J=7.2\text{ Hz}$), 6.50 (1H, s), 6.88 (1H, t, $J=7.5\text{ Hz}$), 7.51 (1H, d, $J=7.5\text{ Hz}$), 7.70 (1H, t, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.90 (1H, dd, $J=8.7, 1.5\text{ Hz}$), 8.09–8.16 (2H, m), 8.18 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 8.52 (1H, d, $J=1.8\text{ Hz}$).

例6 1 (化合物3-8) 収率65.8%

(DMSO- d_6): δ 4.50 (3H, s), 4.46 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 7.37-7.45 (2H, m), 7.48-7.53 (3H, m), 7.71 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 7.81 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.87-7.93 (2H, m), 8.05-8.14 (3H, m), 8.34 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 8.56 (1H, d, $J=1.8$ Hz).

例6 2 (化合物3-9) 収率94.3%

(DMSO- d_6): δ 1.87 (3H, s), 2.48 (3H, s), 4.01 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 5.75 (1H, dd, $J=3.0, 1.2$ Hz), 6.01 (1H, d, $J=3.0$ Hz), 7.49 (2H, dd, $J=7.2, 0.6$ Hz), 7.68 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 7.81 (1H, dd, $J=9.0, 1.8$ Hz), 8.06 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 8.08 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.29 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 8.43 (1H, d, $J=1.8$ Hz).

例6 3 (化合物3-10) 収率99.5%

(DMSO- d_6): δ 2.48 (3H, s), 4.14 (2H, d, $J=6.3$ Hz), 7.16 (1H, ddd, $J=7.5, 4.8, 1.2$ Hz), 7.35 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.50 (1H, dd, $J=7.5, 1.2$ Hz), 7.63-7.72 (2H, m), 7.87 (1H, dd, $J=9.0, 1.8$ Hz), 8.07 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 8.10 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.37 (1H, ddd, $J=4.8, 1.8, 0.9$ Hz), 8.44 (1H, t, $J=6.3$ Hz), 8.49 (1H, d, $J=1.5$ Hz).

例6 4 (化合物3-11) 収率59.6%

(DMSO- d_6): δ 0.73-0.86 (2H, m), 1.06-1.13 (3H, m), 1.33 (1H, m), 1.54-1.66 (5H, m), 2.48 (3H, s), 2.60 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 7.50 (1H, dd, $J=7.5, 0.9$ Hz), 7.69 (1H, t, $J=8.1$ Hz), 7.74 (1

H, t, $J=6.0$ Hz), 7.86 (1H, dd, $J=8.7, 1.8$ Hz), 8.11 (1H, d, $J=7.2$ Hz), 8.13 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.49 (1H, d, $J=1.8$ Hz).

例65 (化合物3-12) 收率88.2%

(DMSO- d_6): δ 2.45 (3H, s), 7.00 (1H, t, $J=7.2$ Hz), 7.11-7.14 (2H, m), 7.18-7.23 (2H, m), 7.49 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 7.67 (1H, t, $J=8.1$ Hz), 7.81 (1H, dd, $J=9.0, 1.5$ Hz), 8.09 (2H, t, $J=9.0$ Hz), 8.51 (1H, d, $J=1.5$ Hz), 10.46 (1H, s).

例66 (化合物3-13) 收率76.7%

(DMSO- d_6): δ 2.40 (3H, s), 2.68 (2H, t, $J=7.5$ Hz), 2.98-3.05 (2H, m), 7.12-7.25 (5H, m), 7.50 (1H, dd, $J=7.5, 0.9$ Hz), 7.69 (1H, t, $J=7.2$ Hz), 7.85 (1H, dd, $J=9.0, 1.8$ Hz), 7.89 (1H, t, $J=5.7$ Hz), 8.09-8.14 (2H, m), 8.50 (1H, d, $J=1.5$ Hz).

例67 (化合物3-14) 收率96.0%

(CD₃OD): δ 1.34 (3H, d, $J=7.2$ Hz), 2.45 (3H, s), 4.47 (1H, q, $J=6.9$ Hz), 6.86-6.92 (1H, m), 6.94-6.99 (2H, m), 7.02-7.06 (2H, m), 7.38 (1H, dd, $J=7.8, 1.2$ Hz), 7.57 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 7.70 (1H, dd, $J=8.7, 1.8$ Hz), 7.77 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 7.88 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.16 (1H, d, $J=1.8$ Hz).

例68 (化合物3-15) 收率87.2%

(DMSO- d_6): δ 2.50 (3H, s), 2.61 (3H, s), 4.22 (2H, s), 7.31-7.40 (5H, m), 7.55 (1H, d, $J=7.$

5 Hz), 7.74 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 7.91 (1H, dd, $J=8.7, 1.5$ Hz), 8.18 (1H, d, $J=8.4$ Hz), 8.19 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.64 (1H, d, $J=1.5$ Hz).

例69: N-ベンジル-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号4-1) の製造

5-アセチルオキシ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号3-1; 62.0 mg, 0.17 mmol) にエタノール (3 ml)、2 規定水酸化ナトリウム溶液 (0.1 ml) を加え、室温で5分間攪拌した。反応混合物を希塩酸にあけ酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧留去して得られた残渣をシリカゲルカラム (展開溶媒; n-ヘキサン: 酢酸エチル = 1:1) で精製して標題化合物の黄白色結晶 (53.3 mg, 100%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$): δ 4.01 (2H, d, $J=6.3$ Hz), 7.04 (1H, dd, $J=7.5, 1.2$ Hz), 7.18–7.31 (5H, m), 7.46 (1H, dd, $J=8.1, 7.5$ Hz), 7.55 (1H, d, $J=8.4$ Hz), 7.75 (1H, dd, $J=8.7, 1.8$ Hz), 8.21 (1H, t, $J=6.3$ Hz), 8.27 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.32 (1H, d, $J=1.8$ Hz), 10.45 (1H, s).

例70～例83: 以下の化合物を例69と同様の製造法により製造した (原料は、例55～例68で製造した化合物である)。

例70 (化合物4-2) 収率69.5%

($\text{DMSO}-d_6$): δ 4.08 (2H, s), 7.04 (1H, dd, $J=7.5, 1.2$ Hz), 7.36 (1H, dd, $J=8.4, 2.4$ Hz), 7.43–7.49 (3H, m), 7.54 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.74 (1H, dd, $J=8.7, 1.5$ Hz), 8.26–8.34 (3H, m), 10.

4.8 (1H, s).

例7.1 (化合物4-3) 收率87.8%

(DMSO- d_6): δ 4.20 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 7.03 (1H, d, $J=7.2$ Hz), 7.42-7.55 (3H, m), 7.72 (2H, t, $J=7.5$ Hz), 7.99 (1H, d, $J=5.7$ Hz), 8.10 (1H, s), 8.25 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.28 (1H, s), 8.45 (1H, t, 6.0 Hz), 10.45 (1H, s).

例7.2 (化合物4-4) 收率99.4%

(CDCl₃): δ 1.24 (9H, s), 4.25 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 4.74 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 5.83 (1H, s), 6.98 (1H, dd, $J=7.5, 0.9$ Hz), 7.10 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.25 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.42 (1H, dd, $J=8.1, 7.8$ Hz), 7.52 (1H, d, $J=8.4$ Hz), 7.79 (1H, dd, $J=8.7, 2.1$ Hz), 8.31 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.37 (1H, d, $J=2.1$ Hz).

例7.3 (化合物4-5) 收率92.4%

(DMSO- d_6): δ 4.13 (1H, d, $J=3.3$ Hz), 7.04 (1H, dd, $J=7.5, 1.2$ Hz), 7.43-7.49 (3H, m), 7.53 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 7.60 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.74 (1H, dd, $J=9.0, 1.8$ Hz), 8.27 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.29 (1H, d, $J=1.8$ Hz), 8.36 (1H, bs), 10.46 (1H, bs)

例7.4 (化合物4-6) 收率67.3%

(DMSO- d_6): δ 3.61 (3H, s), 3.74 (3H, s), 3.99 (2H, d, $J=6.3$ Hz), 6.86-6.91 (2H, m), 6.70 (1H, dd, $J=8.1, 7.2$ Hz), 7.04 (1H, dd, $J=7.2, 1.2$ Hz), 7.46 (1H, dd, $J=8.4, 7.2$ Hz), 7.55 (1H,

d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.76 (1H, dd, $J=9.0, 2.1\text{ Hz}$), 8.07 (1H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 8.28 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.31 (1H, d, $J=1.8\text{ Hz}$), 10.45 (1H, s).

例75 (化合物4-7) 收率88.9%

(DMSO- d_6): δ 3.82 (2H, d, $J=6.3\text{ Hz}$), 5.05 (2H, s), 6.36 (1H, d, $J=7.5\text{ Hz}$), 6.40-6.43 (1H, m), 6.51 (1H, s), 6.90 (1H, t, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.04 (1H, dd, $J=7.8, 1.2\text{ Hz}$), 7.46 (1H, t, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.56 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.77 (1H, dd, $J=8.7, 1.5\text{ Hz}$), 8.07 (1H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 8.29 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.33 (1H, d, $J=1.8\text{ Hz}$), 10.46 (1H, s).

例76 (化合物4-8) 收率95.0%

(DMSO- d_6): δ 4.44 (2H, d, $J=6.0\text{ Hz}$), 7.05 (1H, d, $J=7.5\text{ Hz}$), 7.38-7.47 (3H, m), 7.50-7.58 (3H, m), 7.80-7.84 (2H, m), 7.91 (1H, dd, $J=6.3, 3.6\text{ Hz}$), 8.08 (1H, dd, $J=6.3, 3.6\text{ Hz}$), 8.23 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 8.30 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.39 (1H, d, $J=1.8\text{ Hz}$), 10.48 (1H, s).

例77 (化合物4-9) 收率86.7%

(DMSO- d_6): δ 1.94 (3H, s), 3.98 (2H, d, $J=6.0\text{ Hz}$), 5.80 (1H, d, $J=1.8\text{ Hz}$), 6.01 (1H, d, $J=2.7\text{ Hz}$), 7.02 (1H, d, $J=7.5\text{ Hz}$), 7.45 (1H, t, $J=7.5\text{ Hz}$), 7.53 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.70 (1H, dd, $J=9.0, 1.8\text{ Hz}$), 8.17 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 8.24 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.25 (1H, s), 10.43 (1H, s)

例78 (化合物4-10) 收率90.5%

(DMSO- d_6): δ 4.12 (2H, d, $J=6.0\text{ Hz}$), 7.04 (1

H, dd, $J=7.5, 0.9\text{ Hz}$), 7.19 (1H, dd, $J=6.6, 4.8\text{ Hz}$), 7.38 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.46 (1H, t, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.55 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.70 (1H, td, $J=7.8, 1.8\text{ Hz}$), 7.76 (1H, dd, $J=9.0, 1.8\text{ Hz}$), 8.27 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.32 (1H, d, $J=1.8\text{ Hz}$), 8.35 (1H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 8.40 (1H, dd, $J=4.8, 0.9\text{ Hz}$), 10.47 (1H, s).

例79 (化合物4-11) 収率79.7%

(DMSO- d_6): δ 0.73-0.88 (2H, m), 1.03-1.15 (3H, m), 1.38 (1H, m), 1.50-1.69 (5H, m), 2.59 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 7.03 (1H, d, $J=6.9\text{ Hz}$), 7.45 (1H, t, $J=7.5\text{ Hz}$), 7.56 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.65 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 7.74 (1H, dd, $J=8.7, 1.8\text{ Hz}$), 8.28 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.30 (1H, s), 10.46 (1H, s).

例80 (化合物4-12) 収率94.3%

(DMSO- d_6): δ 6.96-7.03 (2H, m), 7.10-7.13 (2H, m), 7.17-7.22 (2H, m), 7.43 (1H, t, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.52 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.69 (1H, dd, $J=9.0, 1.8\text{ Hz}$), 8.23 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.30 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$), 10.35 (1H, s), 10.47 (1H, s).

例81 (化合物4-13) 収率94.5%

(DMSO- d_6): δ 2.67 (2H, t, $J=7.5\text{ Hz}$), 2.96-3.03 (2H, m), 7.03 (1H, d, $J=7.5\text{ Hz}$), 7.12-7.26 (5H, m), 7.45 (1H, t, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.56 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 8.28 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.31 (1H, d, $J=1.2\text{ Hz}$), 10.47 (1H, s).

例 8 2 (化合物 4-14) 収率 89.8%

(DMSO- d_6): δ 1.19 (3H, d, $J=6.9$ Hz), 4.40 (1H, m), 7.01 (1H, dd, $J=6.9, 1.8$ Hz), 7.07 (1H, tt, $J=6.9, 1.8$ Hz), 7.10-7.23 (4H, m), 7.39-7.48 (2H, m), 7.66 (1H, dd, $J=8.7, 2.1$ Hz), 8.18 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.19 (1H, d, $J=2.7$ Hz), 8.26 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 10.41 (1H, s).

例 8 3 (化合物 4-15) 収率 89.8%

(DMSO- d_6): δ 2.59 (3H, s), 4.20 (2H, s), 7.08 (1H, dd, $J=8.7, 0.9$ Hz), 7.28-7.40 (5H, m), 7.50 (1H, t, $J=8.4$ Hz), 7.64 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 7.79 (1H, dd, $J=8.7, 1.5$ Hz), 8.36 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.43 (1H, d, $J=1.8$ Hz), 10.54 (1H, s).

例 8 4: 5-アセチルアミノ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミド (化合物番号 5-1) の製造

(1) 5-(アセチルアミノ)ナフタレン-2-スルホニルクロリドの製造

米国特許第 5378715 号に開示された製造法に従って製造した。

(2) 5-アセチルアミノ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミドの製造

ベンジルアミン (127 mg, 1.19 mmol)、トリエチルアミン (0.17 ml, 1.22 mmol) のテトラヒドロフラン (3.0 ml) 溶液に、5-(アセチルアミノ)ナフタレン-2-スルホニルクロリド (280 mg, 0.987 mmol) を加え、室温にて 1 時間攪拌した。反応液に水 (10 ml) を加え 10 分間攪拌後、生じた固体をろ取した。水、イソプロピルエーテルにて洗浄し、標題化合物を淡桃色固体 (296 mg, 84.6%) として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6): δ 2.21 (3H, s), 4.03 (2H, d,

$J=6.3\text{ Hz}$), $7.18-7.26$ (5H, m), 7.64 (1H, t, $J=8.1\text{ Hz}$), $7.83-7.88$ (2H, m), 7.98 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.25 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.28 (1H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 8.44 (1H, d, $J=1.8\text{ Hz}$), 10.06 (1H, s).

例85～例87:以下の化合物を例84(2)と同様の製造法により製造した。

例85 (化合物5-2) 収率85.7%

(DMSO- d_6): δ 1.18 (9H, s), 2.20 (3H, s), 3.98 (2H, d, $J=6.3\text{ Hz}$), 7.13 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.24 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.62 (1H, t, $J=7.8\text{ Hz}$), $7.80-7.86$ (2H, m), 7.94 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.21 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 8.22 (1H, d, $J=9.3\text{ Hz}$), 8.38 (1H, d, $J=1.8\text{ Hz}$), 10.04 (1H, s).

例86 (化合物5-3) 収率80.7%

(DMSO- d_6): δ 2.21 (3H, s), 3.61 (3H, s), 3.73 (3H, s), 4.00 (2H, d, $J=6.0\text{ Hz}$), $6.86-6.90$ (2H, m), 6.97 (1H, dd, $J=8.4, 7.5\text{ Hz}$), 7.64 (1H, t, $J=7.8\text{ Hz}$), $7.84-7.89$ (2H, m), 7.97 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 8.13 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 8.25 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.43 (1H, d, $J=1.8\text{ Hz}$), 10.06 (1H, s).

例87 (化合物5-4) 収率63.9%

(DMSO- d_6): δ 1.19 (3H, d, $J=6.9\text{ Hz}$), 2.20 (3H, s), $4.36-4.46$ (1H, m), $7.03-7.08$ (1H, m), $7.12-7.23$ (4H, m), 7.60 (1H, t, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.78 (1H, dd, $J=9.0, 2.1\text{ Hz}$), 7.83 (1H, d, $J=7.5\text{ Hz}$), 7.88 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 8.18 (1H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.28 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$), 8.32 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$),

10.01 (1H, s).

例88：5-アミノ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミド塩酸塩（化合物番号6-1）の製造

5-アセチルアミノ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミド（化合物番号5-1；175mg，0.494mmol）を1-プロパノール（3.0ml）、水（1.5ml）の混合溶媒に懸濁し、濃塩酸（1.5ml）を加え、1時間加熱還流した。室温まで放冷した後、析出した結晶をろ取し、1-プロパノール、イソプロピルエーテルにて洗浄し、標題化合物を淡黄色結晶（128mg，74.4%）として得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$): δ 4.03 (2H, d, $J=6.0\text{Hz}$), 7.17–7.27 (5H, m), 7.47 (1H, d, $J=6.3\text{Hz}$), 7.59 (1H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 7.84–7.90 (2H, m), 8.26 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.32 (1H, t, $J=6.3\text{Hz}$), 8.42 (1H, d, $J=1.5\text{Hz}$).

例89～例91：以下の化合物を例88と同様の製造法により製造した（原料は、例85～例87で製造した化合物である）。

例89（化合物6-2）収率74.1%

($\text{DMSO}-d_6$): δ 1.19 (9H, s), 3.99 (2H, d, $J=6.0\text{Hz}$), 7.15 (2H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.22–7.26 (2H, m), 7.48 (1H, d, $J=7.2\text{Hz}$), 7.58 (t, $J=7.8\text{Hz}$), 7.83–7.90 (2H, m), 8.25 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 8.28 (1H, t, $J=6.0\text{Hz}$), 8.37 (1H, d, $J=1.8\text{Hz}$).

例90（化合物6-3）収率80.5%

($\text{DMSO}-d_6$): δ 3.61 (3H, s), 3.74 (3H, s), 4.00 (1H, d, $J=5.7\text{Hz}$), 6.87–6.91 (2H, m), 6.96 (1

H, d, $J=7.2\text{ Hz}$), 7.45 (1H, d, $J=7.5\text{ Hz}$), 7.59 (1H, t, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.83–7.90 (2H, m), 8.17 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 8.26 (1H, d, $J=9.3\text{ Hz}$), 8.41 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$).

例91 (化合物6-4) 収率73.3%

(DMSO- d_6): δ 1.19 (3H, d, $J=7.2\text{ Hz}$), 4.37–4.47 (1H, m), 7.02–7.08 (1H, m), 7.12–7.23 (4H, m), 7.37 (1H, d, $J=7.2\text{ Hz}$), 7.53 (1H, t, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.70 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.76 (1H, dd, $J=8.7, 1.8\text{ Hz}$), 8.16 (1H, d, $J=9.3\text{ Hz}$), 8.24 (1H, d, $J=1.8\text{ Hz}$), 8.34 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$).

例92: 6-アセチルアミノ-N-ベンジルナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号7-1) の製造

(1) 6-(アセチルアミノ)ナフタレン-1-スルホニルクロリドの製造

米国特許第5378715号に開示された製造法に従って製造した。

(2) 6-アセチルアミノ-N-ベンジルナフタレン-1-スルホンアミドの製造

ベンジルアミン (127mg, 1.19mmol)、トリエチルアミン (0.17ml, 1.22mmol) のテトラヒドロフラン (3.0ml) 溶液に、6-(アセチルアミノ)ナフタレン-1-スルホニルクロリド (280mg, 0.987mmol) を加え、室温にて1時間攪拌した。反応液に水 (10ml) を加え10分間攪拌後、生じた固体をろ取した。水、酢酸エチル/イソプロピルエーテル (1/1) 混合液にて洗浄し、標題化合物を白色固体 (284mg, 81.1%) として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6): δ 2.13 (3H, s), 4.01 (1H, d, $J=6.3\text{ Hz}$), 7.13–7.20 (5H, m), 7.54 (1H, t, $J=$

7. 8 Hz), 7. 71 (1H, dd, $J=9.3, 2.1$ Hz), 7. 97 (1H, dd, $J=7.5, 1.2$ Hz), 8. 08 (1H, d, $J=8.4$ Hz), 8. 43–8. 47 (2H, m), 8. 58 (1H, d, $J=9.3$ Hz), 10. 30 (1H, s).

例93～例94:以下の化合物を例92(2)と同様の製造法により製造した。

例93 (化合物7-2) 収率88.4%

(DMSO- d_6): δ 1. 20 (9H, s), 2. 13 (3H, s), 3. 96 (2H, d, $J=5.7$ Hz), 7. 01 (2H, d, $J=8.1$ Hz), 7. 15 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7. 52 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 7. 70 (1H, dd, $J=9.3, 2.1$ Hz), 7. 94 (1H, dd, $J=7.2, 0.9$ Hz), 8. 05 (1H, d, $J=7.8$ Hz), 8. 37 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 8. 42 (1H, d, $J=1.8$ Hz), 8. 56 (1H, d, $J=9.3$ Hz), 10. 29 (1H, s).

例94 (化合物7-3) 収率84.8%

(DMSO- d_6): δ 2. 13 (3H, s), 3. 55 (3H, s), 3. 74 (3H, s), 4. 00 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 6. 78 (1H, dd, $J=5.7, 3.9$ Hz), 6. 86–6. 89 (2H, m), 7. 55 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 7. 71 (1H, dd, $J=9.3, 2.1$ Hz), 7. 98 (1H, dd, $J=7.5, 1.2$ Hz), 8. 09 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8. 29 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 8. 44 (1H, d, $J=1.8$ Hz), 8. 60 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 10. 30 (1H, s).

例95: 6-アミノ-N-ベンジルナフタレン-1-スルホンアミド塩酸塩 (化合物番号8-1) の製造

6-アセチルアミノ-N-ベンジルナフタレン-1-スルホンアミド (化合物番号7-1; 188mg, 0.530mmol) を1-プロパノール (3.0m

1)、水 (1.5 ml) の混合溶媒に懸濁し、濃塩酸 (1.5 ml) を加え、1時間加熱還流した。室温まで放冷した後、析出した結晶をろ取し、1-プロパノール、イソプロピルエーテルにて洗浄し、標題化合物を淡黄色結晶 (118 mg, 63.8%) として得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$): δ 4.02 (2H, d, $J=6.3\text{ Hz}$), 7.13–7.20 (5H, m), 7.49 (1H, dd, $J=9.0, 2.4\text{ Hz}$), 7.57 (1H, t, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.69 (1H, d, $J=1.8\text{ Hz}$), 7.99 (1H, dd, $J=7.5, 1.2\text{ Hz}$), 8.53 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 8.63 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$).

例96～例97: 以下の化合物を例88と同様の製造法により製造した (原料は、例93～例94で製造した化合物である)。

例96 (化合物8-2) 収率35.4%

($\text{DMSO}-d_6$): δ 1.21 (9H, s), 3.97 (2H, d, $J=6.0\text{ Hz}$), 7.04 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.17 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.42 (1H, dd, $J=8.7, 2.4\text{ Hz}$), 7.52 (1H, t, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.56 (1H, bs), 7.92 (1H, dd, $J=7.2, 0.9\text{ Hz}$), 8.04 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 8.42 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 8.58 (1H, d, $J=9.3\text{ Hz}$).

例97 (化合物8-3) 収率39.8%

($\text{DMSO}-d_6$): δ 3.55 (3H, s), 3.74 (3H, s), 4.01 (2H, d, $J=6.0\text{ Hz}$), 6.79 (1H, dd, $J=6.0, 3.3\text{ Hz}$), 6.86–6.90 (2H, m), 7.45 (1H, dd, $J=9.3, 2.1\text{ Hz}$), 7.58 (1H, t, $J=7.8\text{ Hz}$), 7.64 (1H, bs), 7.98 (1H, dd, $J=7.5, 0.9\text{ Hz}$), 8.10 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 8.35 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 8.63 (1H, d, $J=9.3\text{ Hz}$).

例 98: 6-アセチルアミノ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミド(化合物番号 9-1) の製造

(1) 6-(アセチルアミノ)ナフタレン-2-スルホニルクロリドの製造

米国特許第 5 3 7 8 7 1 5 号に開示された製造法に従って製造した。

(2) 6-アセチルアミノ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミドの製造

ベンジルアミン (127 mg, 1.19 mmol)、トリエチルアミン (0.17 ml, 1.22 mmol) のテトラヒドロフラン (3.0 ml) 溶液に、6-アセチルアミノナフタレン-2-スルホニルクロリド (280 mg, 0.987 mmol) を加え、室温にて 1 時間攪拌した。反応液に水 (10 ml) を加え 10 分間攪拌後、生じた固体をろ取した。水、酢酸エチル/イソプロピルエーテル (1/1) 混合液にて洗浄し、標題化合物を白色固体 (307 mg, 87.7%) として得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$): δ 2.14 (3H, s), 4.00 (2H, d, $J=6.3\text{ Hz}$), 7.17–7.25 (5H, m), 7.68 (1H, dd, $J=8.7, 1.8\text{ Hz}$), 7.76 (1H, dd, $J=8.4, 1.8\text{ Hz}$), 7.99 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.07 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.16 (1H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 8.33 (1H, d, $J=1.8\text{ Hz}$), 8.42 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$), 10.33 (1H, s).

例 99～例 100: 以下の化合物を例 98 (2) と同様の製造法により製造した。

例 99 (化合物 9-2) 収率 84.7%

($\text{DMSO}-d_6$): δ 1.19 (9H, s), 2.13 (3H, s), 3.96 (2H, d, $J=6.0\text{ Hz}$), 7.13 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.22 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.67 (1H, dd, $J=8.7, 1.8\text{ Hz}$), 7.73 (1H, dd, $J=8.4, 1.8\text{ Hz}$), 7.96 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.07 (1H, d, $J=9.0\text{ Hz}$), 8.16 (1H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 8.33 (1H, d, $J=1.8\text{ Hz}$), 8.42 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$), 10.33 (1H, s).

0 Hz), 8.04 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 8.13 (1H, t, $J=6.3$ Hz), 8.28 (1H, d, $J=1.8$ Hz), 8.41 (1H, d, $J=1.5$ Hz), 10.32 (1H, s).

例100 (化合物9-3) 収率88.5%

(DMSO- d_6): δ 2.13 (3H, s), 3.60 (3H, s), 3.74 (3H, s), 3.99 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 6.85-6.90 (2H, m), 6.96 (1H, dd, $J=8.4, 7.2$ Hz), 7.68 (1H, dd, $J=8.7, 1.8$ Hz), 7.77 (1H, dd, $J=8.7, 1.8$ Hz), 7.98-8.08 (3H, m), 8.32 (1H, d, $J=1.2$ Hz), 8.42 (1H, d, $J=1.2$ Hz), 10.33 (1H, s).

例101: 6-アミノ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミド塩酸塩(化合物番号10-1)の製造

6-アセチルアミノ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミド(化合物番号9-1; 18.5 mg, 0.522 mmol)を1-プロパノール(3.0 ml)、水(1.5 ml)の混合溶媒に懸濁し、濃塩酸(1.5 ml)を加え、1時間加熱還流した。室温まで放冷した後、析出した結晶をろ取し、1-プロパノール、イソプロピルエーテルにて洗浄し、標題化合物を淡黄色結晶(135 mg, 74.2%)として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6): δ 3.99 (2H, d, $J=5.7$ Hz), 7.12-7.25 (5H, m), 7.35 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 7.46 (1H, s), 7.75 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 7.93 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.04 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.18 (1H, t, $J=6.3$ Hz), 8.31 (1H, s).

例102~例103: 以下の化合物を例88と同様の製造法により製造した(原料は、例99~例100で製造した化合物である)。

例102 (化合物10-2) 収率78.1%

(DMSO- d_6): δ 1.19 (9H, s), 3.99 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 7.15 (2H, d, $J=8.7$ Hz), 7.22-7.26 (2H, m), 7.48 (1H, d, $J=7.2$ Hz), 7.58 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 7.83-7.90 (2H, m), 8.25 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 8.37 (1H, d, $J=1.8$ Hz).

例103 (化合物10-3) 収率67.3%

(DMSO- d_6): δ 3.60 (3H, s), 3.73 (3H, s), 3.98 (2H, d, $J=5.4$ Hz), 6.86-6.99 (3H, m), 7.36 (1H; d, $J=8.7$ Hz), 7.47 (1H, s); 7.76 (1H, dd, $J=8.7, 1.8$ Hz), 7.94 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.02-8.06 (2H, m), 8.31 (1H, s)

例104: 5-アミノ-N-ベンジルナフタレン-1-カルボキサミド (化合物番号11-1) の製造

(1) 5-ニトロナフタレン-1-カルボン酸の製造

テトラヘドロン (Tetrahedron)、第49巻、第17号、3655-3663ページ (1993年発行) に開示された製造法に従って製造した。

(2) N-ベンジル-5-ニトロナフタレン-1-カルボキサミドの製造

5-ニトロナフタレン-1-カルボン酸 (250mg, 1.15mmol) の無水テトラヒドロフラン (3ml) 懸濁液に、氷冷下トリエチルアミン (0.16ml, 1.15mmol) クロロギ酸エチル (0.11ml, 1.115mmol) を加え、0.5時間攪拌した。反応混合液にベンジルアミン (0.13ml, 1.20mmol) を加え、室温にて6時間攪拌した。反応液に水を加え10分間攪拌後、生じた沈殿をろ取した。沈殿を水、ジイソプロピルエーテルで洗浄後乾燥し、標題化合物を淡褐色固体 (189mg, 53.5%) として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6): δ 4.57 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 7.

2.6–7.31 (1H, m), 7.34–7.44 (4H, m), 7.77 (1H, dd, $J=8.4, 7.8$ Hz), 7.84–7.85 (2H, m), 8.33 (1H, dd, $J=7.5, 0.9$ Hz), 8.36–8.41 (1H, m), 8.55 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 9.28 (1H, t, $J=6.0$ Hz).

(3) 5-アミノ-N-ベンジルナフタレン-1-カルボキサミドの製造

N-ベンジル-5-ニトロナフタレン-1-カルボキサミド (128 mg, 0.418 mmol) のメタノール (2.5 ml) 懸濁液に、5%パラジウム-炭素 (14 mg) を加え、水素置換した後室温で2時間攪拌した。ろ過してパラジウム-炭素を除去し、ろ液を濃縮した。残留物をイソプロピルエーテル：酢酸エチル (1:1) 混合液にて固化、固体をイソプロピルエーテルにて洗浄後乾燥し、標題化合物を淡黄色固体 (102 mg, 88.7%) として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6): δ 4.51 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 5.77 (2H, s), 6.70 (1H, dd, $J=7.5, 1.2$ Hz), 7.19–7.40 (8H, m), 7.49 (1H, dd, $J=7.2, 1.2$ Hz), 8.15 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 8.95 (1H, t, $J=6.0$ Hz).

例105: 5-アミノ-N-[4-(tert-ブチル)ベンジル]ナフタレン-1-カルボキサミド (化合物番号11-2) の製造

(1) N-[4-(tert-ブチル)ベンジル]-5-ニトロナフタレン-1-カルボキサミドの製造

5-ニトロナフタレン-1-カルボン酸 (197 mg, 0.907 mmol)、4-tert-ブチルベンジルアミン (107 mg, 0.998 mmol) を用いて例104の(2)と同様の操作を行い、標題化合物の淡黄色固体 (140 mg, 42.6%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$): δ 1.32 (9H, s), 4.72 (1H, d, $J=5.4$ Hz), 6.29 (1H, s), 7.34 (2H, d, $J=8.7$ Hz), 7.42 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.64 (1H, dd, $J=8.7, 7.7$ Hz).

2 Hz), 7.68 (1H, dd, $J=8.7, 7.2$ Hz), 7.74 (1H, dd, $J=7.2, 1.5$ Hz), 8.24 (1H, dd, $J=7.5, 1.2$ Hz), 8.60 (1H, dt, $J=7.5, 1.5$ Hz), 8.71 (1H, dt, $J=8.4, 1.2$ Hz).

(2) 5-アミノ-N-[4-(tert-ブチル)ベンジル]ナフタレン-1-カルボキサミドの製造

N-[4-(tert-ブチル)ベンジル]-5-ニトロナフタレン-1-カルボキサミド (140 mg, 0.386 mmol) を用いて例104の(3)と同様の操作を行い、標題化合物の黄色固体 (97 mg, 75.8%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6): δ 1.28 (9H, s), 4.47 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 6.71 (1H, dd, $J=7.5, 0.9$ Hz), 7.22 (1H, dd, $J=8.4, 7.5$ Hz), 7.30 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.33-7.41 (2H, m), 7.38 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.48 (1H, dd, $J=6.9, 1.2$ Hz), 8.14 (1H, d, $J=8.7$ Hz), 8.91 (1H, t, $J=6.0$ Hz).

例106: 5-アミノ-N-(2,3-ジメトキシベンジル)ナフタレン-1-カルボキサミド (化合物番号11-3) の製造

(1) N-(2,3-ジメトキシベンジル)-5-ニトロナフタレン-1-カルボキサミドの製造

5-ニトロナフタレン-1-カルボン酸 (250 mg, 1.15 mmol)、2,3-ジメトキシベンジルアミン (0.18 ml, 1.20 mmol) を用いて例104の(2)と同様の操作を行い、標題化合物の灰白色固体 (232 mg, 55.0%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6): δ 3.81 (3H, s), 3.82 (3H, s), 4.58 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 6.98-7.00 (2H, m), 7.09 (1H, dd, $J=8.7, 6.9$ Hz), 7.70 (1H, dd, 8.4,

7. 8 Hz), 7. 83–7. 85 (2H, m), 8. 33 (1H, dd, $J=7.5$, 1. 2 Hz), 8. 36–8. 40 (1H, m), 8. 55 (1H, dt, $J=8.4$, 0. 9 Hz), 9. 15 (1H, t, $J=6.0$ Hz).

(2) 5-アミノ-N-(2, 3-ジメトキシベンジル) ナフタレン-1-カルボキサミドの製造

N-(2, 3-ジメトキシベンジル)-5-ニトロナフタレン-1-カルボキサミド (168 mg, 0. 459 mmol) を用いて例104の(3)と同様の操作を行い、標題化合物の淡桃色固体 (147 mg, 95. 4%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6): δ 3. 79 (3H, s), 3. 81 (3H, s), 4. 52 (2H, d, $J=6.3$ Hz), 5. 78 (2H, s), 6. 70 (1H, dd, $J=7.2$, 0. 6 Hz), 6. 95–6. 99 (2H, m), 7. 06 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 7. 22 (1H, t, $J=8.7$ Hz), 7. 33 (1H, d, $J=8.4$ Hz), 7. 38 (1H, dd, $J=8.4$, 7. 2 Hz), 7. 49 (1H, dd, $J=7.2$, 0. 6 Hz), 8. 15 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 8. 82 (1H, t, $J=5.7$ Hz 9).

試験例

上記合成化合物を用い、単独投与での Jurkat 細胞増殖に対する作用、或いはブレオマイシンとの併用投与による細胞増殖抑制効果を検討した。材料と方法は以下のとおりである。大日本製薬から入手した Jurkat 細胞を96穴の培養プレート上に1穴あたり約10, 000個播種し、37℃、5%CO₂インキュベーター内で、10%ウシ胎仔血清 (Irvine Scientific) を加えたRPMI 1640 (ICN) 培地内で培養した。このとき、それぞれの化合物を単独で加えるか、或いはさらにそれらにブレオマイシン (Wako) を5 $\mu\text{g}/\text{ml}$ または10 $\mu\text{g}/\text{ml}$ となるように加えた。培養36時間後、MTS法により生存細胞数の測定を行った。

具体的には、Cell Titer 96™ Aqueous OneSolut

ion (Promega) を1穴あたり $20 \mu\text{l}$ 加え、さらに1時間培養を続け、 490 nm での吸光度をマイクロプレートリーダーで測定した。溶媒として用いたジメチルスルホキシド (DMSO) を最終濃度が0.25%となるように加えたものを対照とし、このときの細胞数を生存率100%とし、それぞれの化合物について、単独或いはブレオマイシンとの併用投与での細胞生存率を求めた。 $5 \mu\text{g/ml}$ または $10 \mu\text{g/ml}$ のブレオマイシンのみの処理では、Jurkat細胞の生存率はおよそ5~10%の減少を示した。これに対し、本発明の化合物を共存させた場合には、 $5 \mu\text{g/ml}$ または $10 \mu\text{g/ml}$ のブレオマイシン存在下でのJurkat細胞の生存率は顕著に低下していた。結果を下記表に示す。表中、「++」は顕著な増強作用、「+」は中程度の増強作用が認められたことを示す。

化合物番号	活性
1-1	++
1-2	+
1-3	++
1-5	++
1-6	++
1-7	++
1-9	++
1-11	++
1-12	+
1-13	+
1-15	+
1-16	+
1-17	++
1-19	++
1-20	+
1-23	+
1-24	++
1-25	+
1-26	++
1-27	+

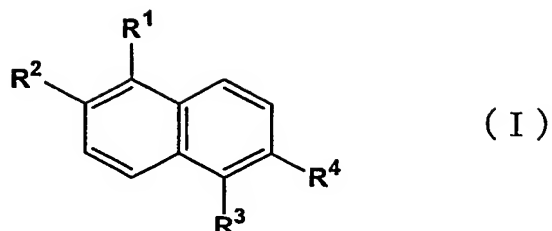
2-3	++
2-7	++
2-8	+
2-9	+
2-11	+
2-13	+
2-19	++
2-23	+
2-25	+
3-1	+
3-4	++
3-5	+
3-9	+
4-1	+
4-3	+
4-4	++
4-5	+
4-6	+
4-7	+
4-8	+
4-13	+
6-2	+
6-3	+
8-2	+
11-1	+

産業上の利用可能性

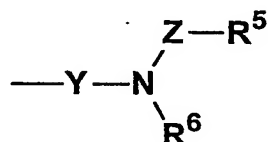
本発明の医薬は、DNA損傷を作用機序とする癌治療において、DNA損傷を受けた癌細胞で活性化されるプロテインキナーゼを阻害し、該癌細胞を死滅させる作用を有する。従って、本発明の医薬は、癌治療の効果を増強し、かつ抗癌剤の投与量及び／又は放射線照射量を低減することによって、癌治療に伴う副作用を軽減することができる。

請求の範囲

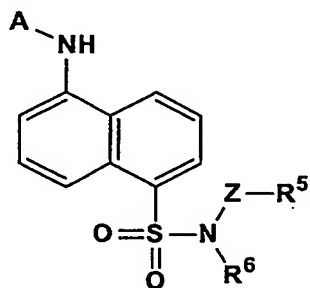
1. 下記一般式 (I) :



〔式中、 R^1 及び R^2 は一方が水素原子、他方が式： $-X-A$ （式中、 A は水素原子又はアシル基を示し、 X は酸素原子又は NH を示す）で表される基を示し； R^3 及び R^4 は一方が水素原子、他方が下記式：



（式中、 Y はスルホニル基又はカルボニル基を示し、 R^5 は置換基を有していてもよい環式基を示し、 Z は単結合又は置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_4$ のアルキレン基を示すが、該 Z が置換基を有する場合には、該置換基は R^5 と結合して環式基を形成してもよく、 R^6 は水素原子又は置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基を示すが、 R^6 は Z 又は R^5 と結合して環式基を形成してもよい）で表される基を示す。ただし、上記一般式 (I) が下記式：



（式中、 A 、 Z 、 R^5 、及び R^6 は上記定義と同意義である）である場合を除く〕で表される化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、DNA損

傷を作用機序とする癌治療の効果を増強するための医薬。

2. R^5 が置換基を有していてもよい芳香環式基である請求の範囲第1項に記載の医薬。

3. Zが置換基を有していてもよいメチレン基（該Zが置換基を有する場合、該置換基は R^5 と結合して環式基を形成してもよい）である請求の範囲第1項又は第2項のいずれか1項に記載の医薬。

4. Yがスルホニル基である請求の範囲第1項ないし第3項のいずれか1項に記載の医薬。

5. R^1 が式： $-O-A$ （式中、Aは水素原子又はアシル基を示す）で表される基であり、 R^2 が水素原子である請求の範囲第1項ないし第4項のいずれか1項に記載の医薬。

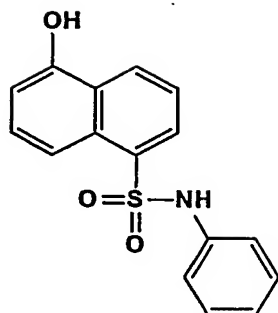
6. DNA損傷を作用機序とする癌治療が抗癌剤の投与及び／又は放射線治療により行われる請求の範囲第1項ないし第5項のいずれか1項に記載の医薬。

7. 抗癌剤がブレオマイシン、アドリアマイシン、シスプラチン、シクロフォスファミド、マイトマイシンC、及びそれらの誘導体からなる群から選ばれる請求の範囲第6項に記載の医薬。

8. プロテインキナーゼ及び／又はその類似酵素の特異的阻害剤である請求の範囲第1項ないし第7項のいずれか1項に記載の医薬。

9. 請求の範囲第1項に記載の一般式（I）で表される化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、DNA損傷を作用機序とする癌治療の副作用を軽減するための医薬。

10. 請求の範囲第1項に記載の一般式（I）で表される化合物（ただし下記の化合物を除く）。



若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物。

11. 下記の化合物からなる群から選ばれる化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物。

N-ベンジル-5-[[4-(4-メチルフェニル)スルホニル]オキシ]ナフタレン-1-スルホンアミド；

N-(2,6-ジフルオロベンジル)-5-[[4-(4-メチルフェニル)スルホニル]オキシ]ナフタレン-1-スルホンアミド；

N-(2,4-ジクロロベンジル)-5-[[4-(4-メチルフェニル)スルホニル]オキシ]ナフタレン-1-スルホンアミド；

N-(3-ニトロベンジル)-5-[[4-(4-メチルフェニル)スルホニル]オキシ]ナフタレン-1-スルホンアミド；

N-(4-ニトロベンジル)-5-[[4-(4-メチルフェニル)スルホニル]オキシ]ナフタレン-1-スルホンアミド；

N-(2-メチルベンジル)-5-[[4-(4-メチルフェニル)スルホニル]オキシ]ナフタレン-1-スルホンアミド；

N-[4-(tert-ブチル)ベンジル]-5-[[4-(4-メチルフェニル)スルホニル]オキシ]ナフタレン-1-スルホンアミド；

N-[2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-5-[[4-(4-メチルフェニル)スルホニル]オキシ]ナフタレン-1-スルホンアミド；

N-[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]-5-[[4-(4-メチルフェニル)

スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- (3, 4-ジヒドロキシベンジル) -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- (2-メトキシベンジル) -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- (3-メトキシベンジル) -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- (2, 3-ジメトキシベンジル) -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- (3, 5-ジメトキシベンジル) -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- (3, 4-メチレンジオキシベンジル) -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- (3-アミノベンジル) -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- [4- (ジメチルアミノ) ベンジル] -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- [4- (メタンسルホニル) ベンジル] -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- (1-ナフチルメチル) -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- [(5-メチルフラン-2-イル) メチル] -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- [(ピリジン-2-イル) メチル] -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- [(ベンゾイミダゾール-2-イル) メチル] -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N-シクロヘキシルメチル-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ}
ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N-フェニル-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ} ナフタレン
-1-スルホンアミド ;

N- (2-フェネチル) -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ}
ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- (1-フェネチル) -5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ}
ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N-ベンジル-N-メチル-5- {[(4-メチルフェニル) スルホニル] オキシ}
ナフタレン-1-スルホンアミド ;

N-ベンジル-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- (2, 6-ジフルオロベンジル) -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホ
ンアミド ;

N- (2, 4-ジクロロベンジル) -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホン
アミド ;

N- (3-ニトロベンジル) -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- (4-ニトロベンジル) -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- (2-メチルベンジル) -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド ;

N- [4- (t e r t -ブチル) ベンジル] -5-ヒドロキシナフタレン-1-
スルホンアミド ;

N- [2- (トリフルオロメチル) ベンジル] -5-ヒドロキシナフタレン-1
-スルホンアミド ;

N- [4- (トリフルオロメチル) ベンジル] -5-ヒドロキシナフタレン-1
-スルホンアミド ;

N- (3, 4-ジヒドロキシベンジル) -5-ヒドロキシナフタレン-1-スル
ホンアミド ;

N- (2-メトキシベンジル) -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミ

ド；

N- (3-メトキシベンジル) -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド；

N- (2, 3-ジメトキシベンジル) -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド；

N- (3, 5-ジメトキシベンジル) -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド；

N- (3, 4-メチレンジオキシベンジル) -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド；

N- (3-アミノベンジル) -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド；

N- [4- (ジメチルアミノ) ベンジル] -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド；

N- [4- (メタンスルホニル) ベンジル] -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド；

N- (1-ナフチルメチル) -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド；

N- [(5-メチルフラン-2-イル) メチル] -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド；

N- [(ピリジン-2-イル) メチル] -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド；

N- [(ベンゾイミダゾール-2-イル) メチル] -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド；

N-シクロヘキシルメチル-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド；

N-フェニル-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド；

N- (2-フェネチル) -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド；

N- (1-フェネチル) -5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド；

N-ベンジル-N-メチル-5-ヒドロキシナフタレン-1-スルホンアミド；

5-アセチルオキシ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミド；

5-アセチルオキシ-N-(2, 4-ジクロロベンジル) ナフタレン-2-スルホンアミド;

5-アセチルオキシ-N-(3-ニトロベンジル) ナフタレン-2-スルホンアミド;

5-アセチルオキシ-N-[4-(tert-ブチル)ベンジル] ナフタレン-2-スルホンアミド;

5-アセチルオキシ-N-[4-(トリフルオロメチル)ベンジル] ナフタレン-2-スルホンアミド;

5-アセチルオキシ-N-(2, 3-ジメトキシベンジル) ナフタレン-2-スルホンアミド;

5-アセチルオキシ-N-(3-アミノベンジル) ナフタレン-2-スルホンアミド;

5-アセチルオキシ-N-(1-ナフチルメチル) ナフタレン-2-スルホンアミド;

5-アセチルオキシ-N-[(5-メチルフラン-2-イル)メチル] ナフタレン-2-スルホンアミド;

5-アセチルオキシ-N-[(ピリジン-2-イル)メチル] ナフタレン-2-スルホンアミド;

5-アセチルオキシ-N-(シクロヘキシルメチル) ナフタレン-2-スルホンアミド;

5-アセチルオキシ-N-フェニルナフタレン-2-スルホンアミド;

5-アセチルオキシ-N-(2-フェネチル) ナフタレン-2-スルホンアミド;

5-アセチルオキシ-N-(1-フェネチル) ナフタレン-2-スルホンアミド;

5-アセチルオキシ-N-ベンジル-N-メチルナフタレン-2-スルホンアミド;

N-ベンジル-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド;

N-(2, 4-ジクロロベンジル)-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホン

アミド；

N-(3-ニトロベンジル)-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド；

N-[4-(tert-ブチル)ベンジル]-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド；

N-[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド；

N-(2,3-ジメトキシベンジル)-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド；

N-(3-アミノベンジル)-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド；

N-(1-ナフチルメチル)-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド；

N-[(5-メチルフラン-2-イル)メチル]-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド；

N-[(ピリジン-2-イル)メチル]-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド；

N-(シクロヘキシルメチル)-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド；

N-フェニル-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド；

N-(2-フェネチル)-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド；

N-(1-フェネチル)-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド；

N-ベンジル-N-メチル-5-ヒドロキシナフタレン-2-スルホンアミド；

5-アセチルアミノ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミド；

5-アセチルアミノ-N-[4-(tert-ブチル)ベンジル]ナフタレン-2-スルホンアミド；

5-アセチルアミノ-N-(2,3-ジメトキシベンジル)ナフタレン-2-スルホンアミド；

5-アセチルアミノ-N-ベンジル-N-メチルナフタレン-2-スルホンアミド；

- 5-アミノ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミド；
- 5-アミノ-N-[4-(tert-ブチル)ベンジル]ナフタレン-2-スルホンアミド；
- 5-アミノ-N-(2,3-ジメトキシベンジル)ナフタレン-2-スルホンアミド；
- 5-アミノ-N-ベンジル-N-メチルナフタレン-2-スルホンアミド；
- 6-アセチルアミノ-N-ベンジルナフタレン-1-スルホンアミド；
- 6-アセチルアミノ-N-[4-(tert-ブチル)ベンジル]ナフタレン-1-スルホンアミド；
- 6-アセチルアミノ-N-(2,3-ジメトキシベンジル)ナフタレン-1-スルホンアミド；
- 6-アミノ-N-ベンジルナフタレン-1-スルホンアミド；
- 6-アミノ-N-[4-(tert-ブチル)ベンジル]ナフタレン-1-スルホンアミド；
- 6-アミノ-N-(2,3-ジメトキシベンジル)ナフタレン-1-スルホンアミド；
- 6-アセチルアミノ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミド；
- 6-アセチルアミノ-N-[4-(tert-ブチル)ベンジル]ナフタレン-2-スルホンアミド；
- 6-アセチルアミノ-N-(2,3-ジメトキシベンジル)ナフタレン-2-スルホンアミド；
- 6-アミノ-N-ベンジルナフタレン-2-スルホンアミド；
- 6-アミノ-N-[4-(tert-ブチル)ベンジル]ナフタレン-2-スルホンアミド；
- 6-アミノ-N-(2,3-ジメトキシベンジル)ナフタレン-2-スルホンアミド；
- 5-アミノ-N-ベンジルナフタレン-1-カルボキサミド；

5-アミノ-N-[4-(tert-ブチル)ベンジル]ナフタレン-1-カルボキサミド;

5-アミノ-N-(2,3-ジメトキシベンジル)ナフタレン-1-カルボキサミド

12. 請求の範囲第10項又は第11項に記載の化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含む医薬。

13. DNA損傷を作用機序とする癌治療の効果を増強するための請求の範囲第12項に記載の医薬。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/04986

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ A61K31/18, 31/22, 31/255, 31/341, 31/36, 31/407, 31/4184, 45/00, 31/166, 31/167, A61P35/00, 43/00, C07D235/14, 307/52, 317/58

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ A61K31/18, 31/22, 31/255, 31/341, 31/36, 31/407, 31/4184, 45/00, 31/166, 31/167, C07D235/14, 307/52, 317/58

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CA (STN), REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 2001-504492 A (BUTENAS, Saulius), 03 April, 2001 (03.04.01), Particularly, page 25; compound 33 & WO 98/22125 A	10,12
X	US 5399487 A (HAEMATOLOGIC TECHNOLOGIES INC.), 21 May, 1995 (21.05.95), Full text (Family: none)	10,12
X	US 5707985 A (TANABE SEIYAKU CO., LTD.), 13 January, 1998 (13.01.98), Particularly, compounds 15, 35 & WO 96/40641 A1	10,12

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"E" earlier document but published on or after the international filing date	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"&" document member of the same patent family
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search 30 May, 2003 (30.05.03)	Date of mailing of the international search report 17 June, 2003 (17.06.03)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/04986

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	Desai, R. D., "Studies in Sulphonamides: Part IV. Some N6-Heterocyclic Sulphonamides from 2-Naphthylamine as possible Antibacterial Agents", Jour. Indian Chem. Soc., 1969, Vol.46, No.5, pages 411 to 415	10,12
X	GB 827446 A (BADISCHE ANILIN- & SODA-FABRIK AKT.-GES.), 03 February, 1960 (03.02.60), Particularly, Claim 3 (Family: none)	10
X	JP 3-217459 A (Mitsui Toatsu Chemicals, Inc.), 25 September, 1991 (25.09.91), Particularly, table 4; examples (Family: none)	10
X	Fujita Satoshi, "Fluorescent Substrates for Potential Use in Enzyme-Linked Immunosorbent Assay of Membrane-Bound Nucleic Acids", Analytical Chemistry, 1994, Vol.66, No.8, pages 1347 to 1353	10
X	JP 48-30733 A (Bayer AG.), 23 April, 1973 (23.04.73), Particularly, example 9 & GB 1364952 A	10
A	JP 5-503721 A (SPINX PHARMACEUTICALS CORP.), 17 June, 1993 (17.06.93), & WO 92/07557 A1	1-9,11,13
A	JP 6-504052 A (THE BIOMEMBRANE INSTITUTE), 12 May, 1994 (12.05.94), & WO 92/12119 A1	1-9,11,13

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ A61K31/18, 31/22, 31/255, 31/341, 31/36, 31/407, 31/4184, 45/00, 31/166, 31/167, A61P35/00, 43/00, C07D235/14, 307/52, 317/58

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ A61K31/18, 31/22, 31/255, 31/341, 31/36, 31/407, 31/4184, 45/00, 31/166, 31/167, C07D235/14, 307/52, 317/58

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)
CA(STN), REGISTRY(STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	JP 2001-504492 A (ブテナス、ザウリアス) 2001.04.03, 特に、第25頁化合物33 & WO 98/22125 A	10, 12
X	US 5399487 A (HAEMATOLOGIC TECHNOLOGIES, INC) 1995.5.21, 全文, ファミリーなし	10, 12
X	US 5707985 A (TANABE SEIYAKU CO. LTD.) 1998.01.13, 特に化合物15, 35 & WO 96/40641 A1	10, 12

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

- 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

- の日の後に公表された文献
「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

30.05.03

国際調査報告の発送日

17.06.03

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)
郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

内藤 伸一



4 P 3230

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	Desai, R. D., "Studies in Sulphonamides: Part IV. Some N6-Heterocyclic Sulphonamides from 2-Naphthylamine as possible Antibacterial Agents", Jour. Indian Chem. Soc., 1969, Vol.46, No.5, page 411-415	10, 12
X	GB 827446 A (BADISCHE ANILIN- & SODA-FABRIK AKT. -GES.) 1960. 02.03, 特に、クレーム3, ファミリーなし	10
X	JP 3-217459 A (三井東圧化学株式会社) 1991.09.25, 特に、表4 実施例, ファミリーなし	10
X	Fujita Satoshi, "Fluorescent Substrates for Potential Use in Enzyme-Linked Immunosorbent Assay of Membrane-Bound Nucleic Acids", Analytical Chemistry, 1994, Vol.66, No.8, page 1347-1353,	10
X	JP 48-30733 A (バイエル・アクチエンゲゼルシャフト) 1973.04.23, 特に、実施例9 & GB 1364952 A	10
A	JP 5-503721 A (スフィンクス・ファーマスーティカल्ス・コーポレーション) 1993.06.17, & WO 92/07557 A1	1-9, 11, 13
A	JP 6-504052 A (サ・バイオメド・インスティテュート) 1994.05.12, & WO 92/12119 A1	1-9, 11, 13